



PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(15) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 249/12, 401/04, 403/04, A01N 43/653, 47/08, C07C 239/08, 271/06</p>	A1	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 96/01258</p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 18. Januar 1996 (18.01.96)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/02395</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 21. Juni 1995 (21.06.95)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: P 44 23 613.1 6. Juli 1994 (06.07.94) DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, D-67227 Frankenthal (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, D-68167 Mannheim (DE). GÖTZ, Norbert [DE/DE]; Schöfferstrasse 25, D-67547 Worms (DE). KÖNIG, Hartmann [DE/DE]; Blumenstrasse 16, D-69115 Heidelberg (DE). RÖHL, Franz [DE/DE]; Sebastian-Kneipp-Strasse 17, D-67105 Schifferstadt (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, D-67434 Hambach (DE). AMMERMAN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, D-64646 Heppenheim (DE).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).</p>		
<p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, FI, HU, JP, KR, KZ, MX, NO, NZ, PL, RU, SG, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p style="text-align: center;">Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p>		
<p>(54) Title: 2-[1',2',4'-TRIAZOL-3'-YLOXYMETHYLENE]-ANILIDES AND THEIR USE AS PEST-CONTROL AGENTS</p> <p>(54) Bezeichnung: 2-(1',2',4'-TRIAZOL-3'-YLOXYMETHYLEN)-ANILIDE UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL</p>		
<p>(57) Abstract</p> <p>The invention concerns 2-[1',2',4'-triazol-3'-yloxymethylene]-anilides of the formula (I) in which the subscript and substituents are as follows: n stands for 0, 1, 2, 3, or 4; X stands for a direct bond, oxygen or NR^a, R^a being hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or cycloalkenyl; R¹ nitro, cyano, halogen or optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxy, alkenyloxy or alkynyloxy; R² hydrogen, nitro, cyano, halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, alkylthio or alkoxy carbonyl; R³ optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, heterocyclyl, aryl or heteroaryl; R⁴ hydrogen or optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, alkylcarbonyl or alkoxy carbonyl; R⁵ hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or cycloalkenyl. The invention also concerns methods of preparing such compounds, intermediates used in their preparation and their use in the control of animal and fungal pests.</p>		
<p>(57) Zusammenfassung</p> <p>2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-anilide der Formel I, in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben: n 0, 1, 2, 3 oder 4; X eine direkte Bindung, O oder NR^a; R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl; R¹ Nitro, Cyano, Halogen, ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder Alkynyloxy; R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkoxy carbonyl; R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl; R⁴ Wasserstoff, ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl; R⁵ Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung, zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen.</p>		
<p style="text-align: right;">(I)</p>		

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

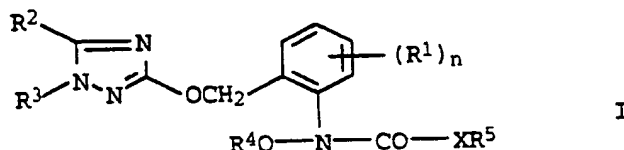
AT	Österreich	GA	Gabon	MR	Mauretanien
AU	Australien	GB	Vereinigtes Königreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GE	Georgien	NE	Niger
BE	Belgien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	IE	Irland	PL	Polen
BR	Brasilien	IT	Italien	PT	Portugal
BY	Belarus	JP	Japan	RO	Rumänien
CA	Kanada	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kasachstan	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LI	Liechtenstein	SN	Senegal
CN	China	LK	Sri Lanka	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanien	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	ML	Mali	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MN	Mongolei	VN	Vietnam

2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-anilide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung

5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxy-methylen]-anilide der Formel I

10



15

in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

20 n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R^1 verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

X eine direkte Bindung, O oder NR^a ;

25 R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;

R^1 Nitro, Cyano, Halogen,

30 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy oder

35 für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

40 R^2 Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl;

R^3 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;

45

2

ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder

5

ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann;

10

R⁴ Wasserstoff,

15

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;

R⁵ Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl oder für den Fall, daß X für NR^a steht, zusätzlich Wasserstoff.

20 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen.

25 Aus der WO-A 93/15,046 sind 2-[1,2,4-Triazol-5-yloxymethylen]-anilide zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen bekannt.

Der vorliegenden Erfindung lagen Verbindungen mit verbesserter
30 Wirkung als Aufgabe zugrunde.

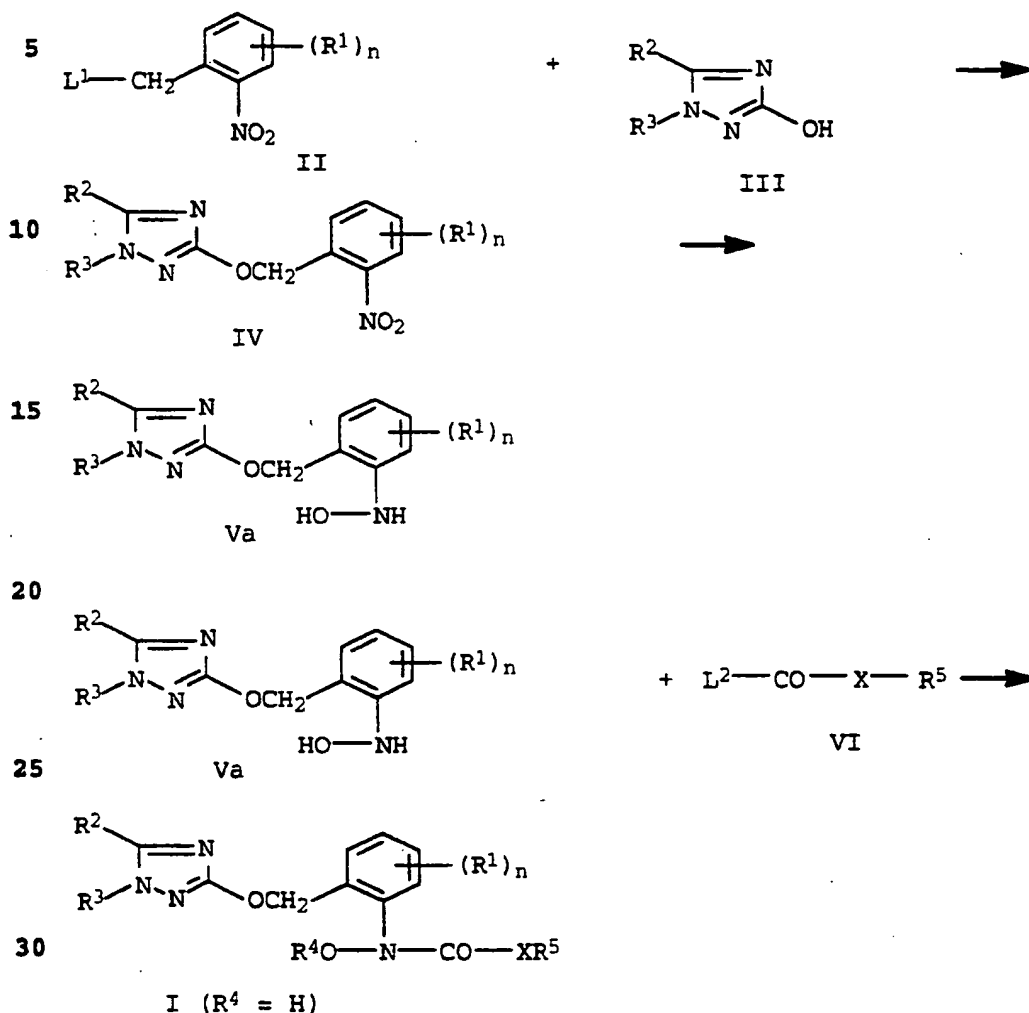
Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen I gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mischungen sowie Verfahren zur Bekämpfung
35 von tierischen Schädlingen und Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen I sind auf verschiedenen Wegen erhältlich.

40 Man erhält diejenigen Verbindungen I, in denen R⁴ Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, beispielsweise dadurch, daß man ein Benzylderivat der Formel II in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III in das entsprechende 2-[1,2,4-Triazol-3-yloxymethylen]-nitrobenzol
45 der Formel IV überführt, IV anschließend zum N-Hydroxylanilin der

3

Formel Va reduziert und Va mit einer Carbonylverbindung der Formel VI in I umwandelt.



35 L^1 in der Formel II und L^2 in der Formel VI bedeuten jeweils eine nucleophil austauschbare Gruppe, beispielsweise Halogen (z.B. Chlor, Brom und Iod), oder ein Alkyl oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat und 4-Methylphenylsulfonat).

40 Die Veretherung der Verbindungen II und III wird üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C, vorzugsweise 20°C bis 60°C, durchgeführt.

45 Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol

4

- und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol, Ketone wie Aceton und Methylethylketon sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid, Dimethylacetamid,
- 5 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on und 1,2-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidin, vorzugsweise Methylenchlorid, Aceton, Toluol, tert.-Butylmethylether und Dimethylformamid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 10 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide (z.B. Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid), Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide (z.B. Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid), Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride (z.B. Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid), Alkalimetallamide (z.B. Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid), Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate (z.B. Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat) sowie Alkalimetallhydrogencarbonate (z.B. Natriumhydrogencarbonat), metall-
- 15 organische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle (z.B. wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium), Alkylmagnesiumhalogenide (z.B. Methylmagnesiumchlorid) sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate (z.B. Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kalium-tert.-Butanolat und
- 20 Dimethoxymagnesium), außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht.
- 25
- 30 Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Kaliumcarbonat und Kalium-tert.-butanolat.
- Die Basen werden im allgemeinen äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet.
- 35
- Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, eine katalytische Menge eines Kronenethers (z.B. 18-Krone-6 oder 15-Krone-5) zuzusetzen.
- 40
- Die Umsetzung kann auch in Zweiphasensystemen bestehend aus einer Lösung von Alkali- oder Erdalkalihydroxiden oder -carbonaten in Wasser und einer organischen Phase (z.B. aromatische und/oder halogenierte Kohlenwasserstoffe) durchgeführt werden. Als Phasentransferkatalysatoren kommen hierbei beispielsweise Ammoniumhalogenide und -tetrafluoroborate (z.B. Benzyltriethylammoniumchlorid, Benzyltributylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumchlorid,
- 45

5

Hexadecyltrimethylammoniumbromid oder Terabutylammoniumtetrafluoroborat) sowie Phosphoniumhalogenide (z.B. Tetrabutylphosphoniumchlorid und Tetraphenylphosphoniumbromid) in Betracht.

- 5 Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, zunächst das 3-Hydroxytriazol mit der Base in das entsprechende Hydroxylat umzusetzen, welches dann mit dem Benzylderivat umgesetzt wird.

- Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe II sind aus EP-A 513 580 bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [Synthesis 1991, 181; Anal. Chim. Acta 185, 295 (1986); EP-A 336 567].

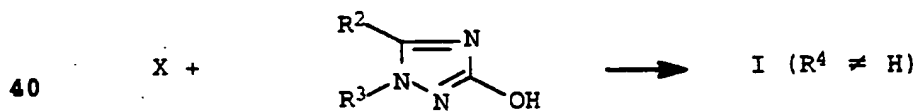
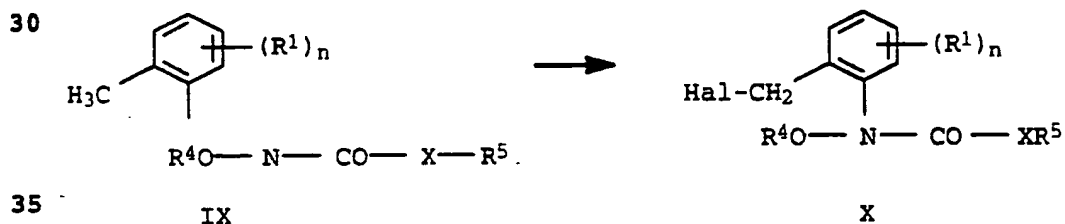
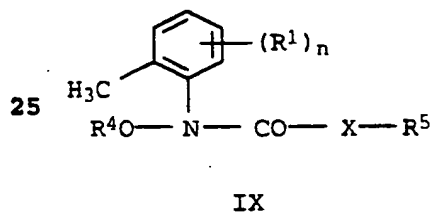
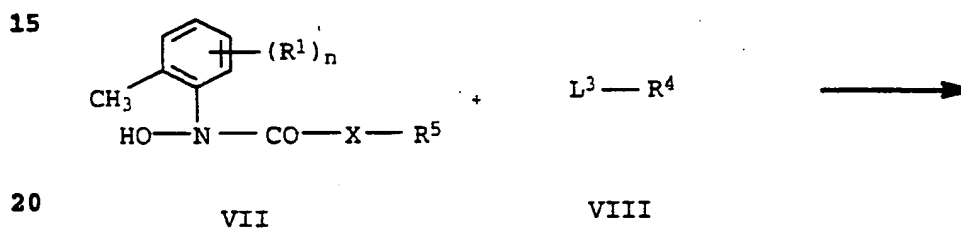
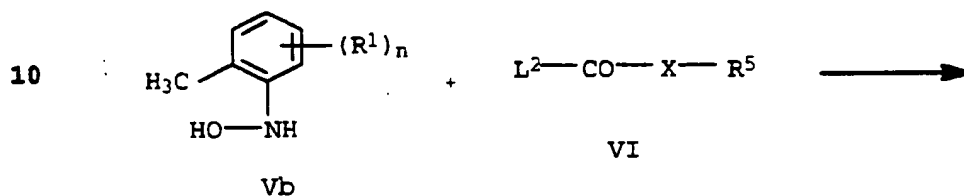
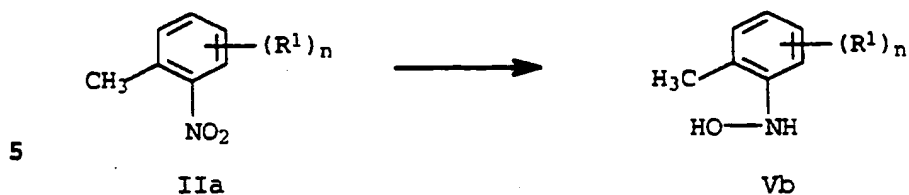
- 3-Hydroxytriazole III sind ebenfalls aus der Literatur bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [Chem. Ber. 56, 1794 (1923); DE-A 21 50 169; DE-A 22 00 436; US-A 4,433,148; J. Med. Chem. 33, 2772 (1990); Synthesis 1987, 986; DE-A 22 60 015; DE-A 24 17 970].

- 20 Die Reduktion der Nitroverbindungen IV zu den entsprechenden N-Hydroxyanilinen IVa erfolgt analog zu literaturbekannten Methoden beispielsweise mit Metallen wie Zink [vgl. Ann. Chem. 316, 278 (1901)] oder mit Wasserstoff (vgl. EP-A 085 890).

- 25 Die Umsetzung der N-Hydroxyaniline Va mit den Carbonylverbindungen VI erfolgt unter alkalischen Bedingungen insbesondere bei Temperaturen von -10°C bis 30°C. Die bevorzugten Lösungsmittel sind Methylenchlorid, Toluol, tert.-Butylmethylether oder Essigsäureethylester. Die bevorzugten Basen sind
- 30 Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydroxid oder wäßrige Natriumhydroxid-Lösung.

- Außerdem erhält man die Verbindungen der Formel I, in denen R⁴ nicht Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder
- 35 Sauerstoff steht, beispielsweise dadurch, daß man ein Benzylderivat der Formel IIa zunächst zum entsprechenden Hydroxyanilin der Formel Vb reduziert, Vb mit einer Carbonylverbindung der Formel VI in das entsprechende Anilid der Formel VII überführt, VII anschließend mit einer Verbindung VIII in das Amid der
- 40 Formel IX umwandelt, IX anschließend in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel X überführt und X in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III in I umwandelt.

6



In der Formel X bedeutet Hal ein Halogenatom, insbesondere Chlor oder Brom.

45

7

L^3 in der Formel VIII bedeutet eine nucleophil austauschbare Gruppe, beispielsweise Halogen (z.B. Chlor, Brom und Iod), oder ein Alkyl oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat und 4-Methylphenylsulfonat) und R^4 steht nicht für Wasserstoff.

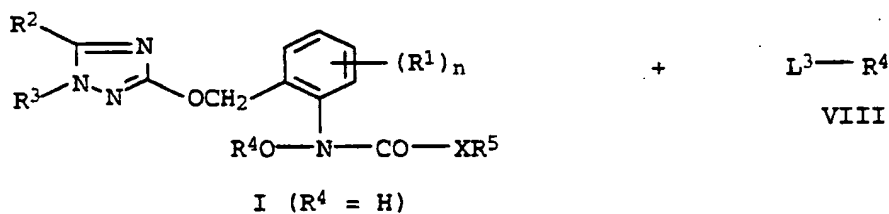
Die Umsetzungen erfolgen analog den vorstehend ausgeführten Verfahren.

- 10 Die Halogenierung der Verbindungen IX erfolgt radikalisch, wobei als Halogenierungsmittel beispielsweise N-Chlor- oder N-Bromsuccinimid, elementare Halogene (z.B. Chlor oder Brom) oder Thionylchlorid, Sulfurylchlorid, Phosphortri- oder Phosphorpentachlorid und ähnliche Verbindungen eingesetzt werden können. Üblicherweise verwendet man zusätzlich einen Radikalstarter (z.B. Azobisisobutyronitril) oder man führt die Umsetzung unter Bestrahlung (mit UV-Licht) durch. Die Halogenierung erfolgt in an sich bekannter Weise in einem üblichen organischen Verdünnungsmittel.

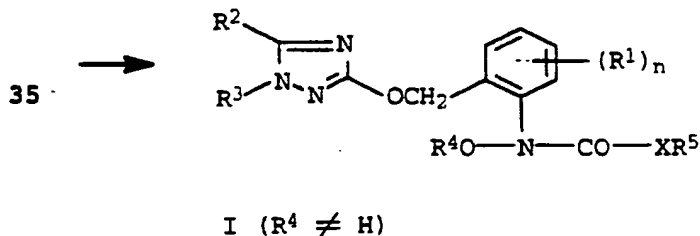
20

Die Verbindungen I, in denen R^4 nicht Wasserstoff bedeutet, erhält man außerdem dadurch, daß man eine entsprechende Verbindung der Formel I, in der R^4 Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der Formel VIII umsetzt.

25



30



35

40

Die Umsetzung erfolgt in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base bei Temperaturen von -20°C bis 50°C .

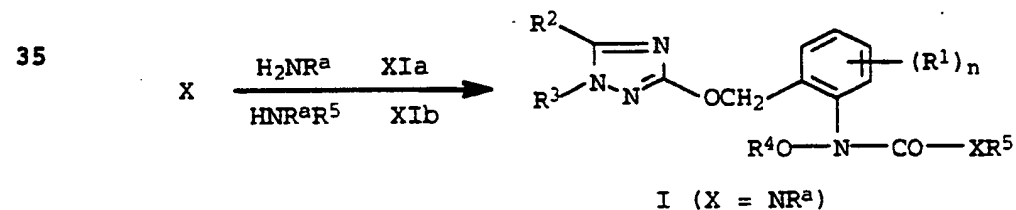
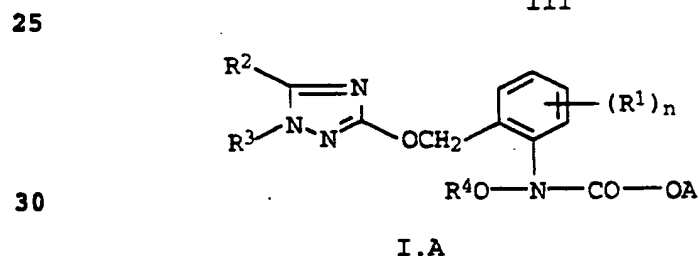
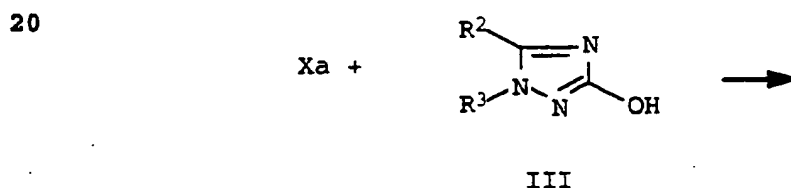
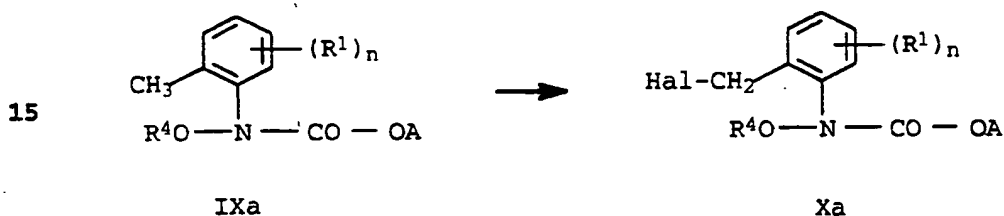
45

Als Basen dienen insbesondere Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydroxid und wäßrige Natriumhydroxid Lösungen.

8

Als Lösungsmittel finden insbesondere Aceton, Dimethylformamid, Toluol, tert.-Butylmethylether, Essigsäureethylester und Methanol Verwendung.

- 5 Die Verbindungen der Formel I, in denen X für NR^a steht, erhält man vorteilhaft dadurch, daß man ein Benzylanilid der Formel IXa in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel Xa überführt, Xa in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III in eine Verbindung der Formel I.A überführt und I.A anschließend
10 mit einem Amin der Formel XI zu I umsetzt.



40

A in den Formeln IXa, Xa und I.A steht für Alkyl (insbesondere C_1 - C_6 -Alkyl) oder Phenyl; Hal in der Formel VIIIa steht für Halogen (insbesondere Chlor und Brom).

45

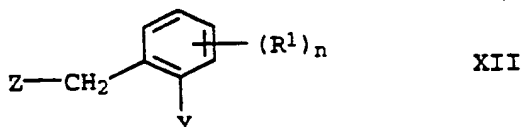
Die Umsetzungen von IXa nach Xa und von Xa nach I.A erfolgen im allgemeinen und im besonderen unter den vorstehend beschriebenen Bedingungen.

- 5 Die Umsetzung der Verbindungen I.A mit den primären oder sekundären Aminen der Formel XIa bzw. XIb erfolgt bei Temperaturen von 0°C bis 100°C in Substanz (lösungsmittelfrei) oder in einem inerten Lösungsmittel oder in einem Lösungsmittelgemisch.
- 10 Als Lösungsmittel eignen sich insbesondere Wasser, tert.-Butylmethylether und Toluol oder deren Gemische. Es kann vorteilhaft sein, zur Verbesserung der Löslichkeit der Edukte zusätzlich eines der folgenden Lösungsmittel (als Lösungsvermittler) zuzusetzen: Tetrahydrofuran, Methanol, Dimethylformamid und Ethylen-
15 glycolether.

Die Amine XIa bzw. XIb werden üblicherweise in einem Überschuß bis zu 100% bezogen auf die Verbindungen eingesetzt oder als Lösungsmittel verwendet. Es kann im Hinblick auf die Ausbeute
20 vorteilhaft sein, die Umsetzung unter Druck durchzuführen.

Die Herstellung der Verbindungen I erfolgt über Zwischenprodukte der Formel XII

25



- 30 in der die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

35

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy oder

40

für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff-
45 und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam

10

mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

Y NO₂, NHOH oder NHOR⁴,

5

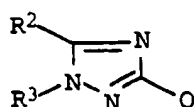
R⁴ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxycarbonyl;

Z Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Nitro, Halogen,

10 C₁-C₆-Alkylsulfonyl, ggf. subst. Arylsulfonyl

oder eine Gruppe Z^a

15

Z^a

20

R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;

25

ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder

30

ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder

35

Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann.

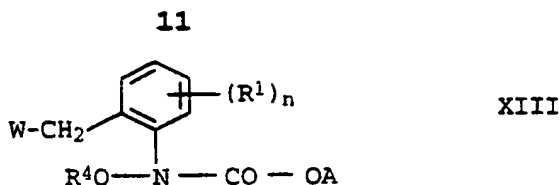
Insbesondere sind bei der Herstellung Zwischenprodukte der Formel XII bevorzugt, in denen Y für NHOH und Z für die Gruppe Z^a steht.

40

Außerdem sind bei der Herstellung Zwischenprodukte der Formel XII bevorzugt, in denen Y für NO₂ und Z für die Gruppe Z^a steht.

Im Hinblick auf die Herstellung der Verbindungen I, in denen X

45 für NR^a steht werden Zwischenprodukte der allgemeinen Formel XIII



5

bevorzugt, wobei die Substituenten R^1 und R^4 sowie der Index n die eingangs gegebene Bedeutung haben und die Substituenten W und A die folgende Bedeutung haben:

10

W Wasserstoff, Halogen oder Z^a und

A Alkyl oder Phenyl.

15 Insbesondere sind hierbei Verbindungen XIII bevorzugt, bei denen der Substituenten W für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Z^a steht.

Außerdem sind solche Verbindungen XIII bevorzugt, bei denen der Substituent A für C_1 - C_6 -Alkyl steht.

20

Insbesondere sind auch solche Verbindungen XIII besonders bevorzugt, in denen der Substituent A für Phenyl steht.

Gleichermaßen bevorzugt sind solche Verbindungen XIII, in denen R^4
25 für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

Daneben werden Verbindungen XIII bevorzugt, in denen n für 0 oder 1 steht.

30 Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen XIII, in denen die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:

n 0,

35 W Wasserstoff, Chlor, Brom oder Z^a ,

R^4 Wasserstoff, Methyl oder Ethyl und

A Phenyl.

40

Die Verbindungen I können saure oder basische Zentren enthalten und dementsprechend Säureadditionsprodukte oder Basenadditionsprodukte oder Salze bilden.

45 Säuren für Säureadditionsprodukte sind u.a. Mineralsäuren (z.B. Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoff- und Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure), orga-

12

nische Säuren (z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Malonsäure, Milchsäure, Äpfelsäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salizylsäure, p-Toluolsulfonsäure, Dodecylbenzolsulfonsäure) oder andere protonenacide Verbindungen (z.B. Saccharin).

5

Basen für Basenadditionsprodukte sind u.a. Oxide, Hydroxide, Carbonate oder Hydrogencarbonate von Alkalimetallen oder Erdalkalimetallen (z.B. Kalium- oder Natriumhydroxyd oder -carbonat) oder Ammoniumverbindungen (z.B. Ammoniumhydroxyd).

10

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden z.T. Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

15 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methyl-

20 propyl und 1,1-Dimethylethyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei diese in Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch

25 Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B.

C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

35 Alkylcarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen, insbesondere mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über

40 ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkoxycarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

45

13

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

- 5 ggf. subst. Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste, insbesondere mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 10 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 15 propyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

ggf. subst. Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste, insbesondere mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B.

- 20 C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 25 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 30 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 35 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 40 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 45 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

14

ggf. subst. Alkenyloxy: geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

- 5 Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen, insbesondere mit 2 bis 20 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethynyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 10 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 15 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- 20 ggf. subst. Alkinyloxy: geradkettige oder verzweigte Alkynylgruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

- 25 ggf. subst. Cycloalkyl: mono- oder bicyclische Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₃-C₁₀-(Bi)cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Bornanyl, Norbornanyl, Dicyclohexyl, Bicyclo[3,3,0]octyl, Bicyclo[3,2,1]octyl, Bicyclo[2,2,2]octyl 30 oder Bicyclo[3,3,1]nonyl;

- ggf. subst. Cycloalkenyl: mono- oder bicyclische Kohlenwasserstoffreste mit 5 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Ringposition, z.B. C₅-C₁₀-(Bi)cycloalkenyl wie 35 Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Bornenyl, Norbornenyl, Dicyclohexenyl und Bicyclo[3,3,0]octenyl;

- eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann: Brücken, die mit dem Ring, an den sie gebunden sind beispielsweise eines der folgenden Systeme 40 bilden: Chinolinyl, Benzofuranyl und Naphthyl; 45

15

- ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, beispielsweise Carbocyclen wie Cyclopropyl,
- 5 Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopent-2-enyl, Cyclohex-2-enyl, 5-bis 6-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte Heterocyclen, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl,
- 10 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl,
- 15 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl,
- 20 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Pyrrolin-2-yl, 2,3-Pyrrolin-3-yl, 2,4-Pyrrolin-2-yl, 2,4-Pyrrolin-3-yl, 2,3-Isloxazolin-3-yl, 3,4-Isloxazolin-3-yl, 4,5-Isloxazolin-3-yl, 2,3-Isloxazolin-4-yl, 3,4-Isloxazolin-4-yl, 4,5-Isloxazolin-4-yl, 2,3-Isloxazolin-5-yl, 3,4-Isloxazolin-5-yl,
- 25 4,5-Isloxazolin-5-yl, 2,3-Isythiazolin-3-yl, 3,4-Isythiazolin-3-yl, 4,5-Isythiazolin-3-yl, 2,3-Isythiazolin-4-yl, 3,4-Isythiazolin-4-yl, 4,5-Isythiazolin-4-yl, 2,3-Isythiazolin-5-yl, 3,4-Isythiazolin-5-yl, 4,5-Isythiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl,
- 30 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl,
- 35 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl,
- 40 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl, vorzugsweise 2-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 1,3,4-Oxazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 4,5-Isloxazolin-3-yl, 3-Piperidin-
- 45

16

nyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 4-Piperidiny1, 2-Tetrahydropyranyl,
4-Tetrahydropyranyl;

- oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ring-
5 system, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoff-
atome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder
Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ring-
glieder enthalten kann, d.h. Arylreste wie Phenyl und Naphthyl,
vorzugsweise Phenyl oder 1- oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste,
10 beispielsweise 5-Ring Heteroaromaten enthaltend ein bis drei
Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie
2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl,
3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothia-
zolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl,
15 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl,
2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazo-
lyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl,
1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl,
1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl,
20 5-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatria-
zol-5-yl, insbesondere 3-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 4-Oxazolyl,
4-Thiazolyl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl;

- Sechsring Heteroaromaten enthaltend ein bis vier Stickstoffatome
25 als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl,
3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl,
5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-
3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl, 3-Pyri-
dinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl und
30 4-Pyridazinyl.

- Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf Alkyl-, Alkenyl- und
Alkynylgruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen par-
tiell oder vollständig halogeniert sein können (d.h. die Wasser-
35 stoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch
gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt
(vorzugsweise Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und
Chlor) ersetzt sein können und/oder einen bis drei, insbesondere
einen, der folgenden Reste tragen können:

40

- C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogen-
alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyloxy,
C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy,
C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyloxy, C₃-C₆-Cycloalkenyl,
45 C₃-C₆-Cycloalkenyloxy,

17

oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ringsystem, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ring-
 5 glieder enthalten kann (wie vorstehend genannt), welches direkt oder über ein Sauerstoffatom (-O-), ein Schwefelatom (-S-) oder eine Aminogruppe (-NR^a-) an den Substituenten gebunden sein kann, d.h.

- 10 Arylreste wie Phenyl und Naphthyl, vorzugsweise Phenyl oder 1- oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste, beispielsweise 5-Ring Heteroaromaten enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isloxazolyl, 15 4-Isloxazolyl, 5-Isloxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 5-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatriazol-5-yl, insbesondere 3-Isloxazolyl, 5-Isloxazolyl, 4-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl;

25

Sechsring Heteroaromaten enthaltend ein bis vier Stickstoffatome als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl und 4-Pyridazinyl.

- Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf die cyclischen (gesättigten, ungesättigten oder aromatischen) Gruppen soll zum Ausdruck
 35 bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können (d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor) ersetzt sein können und/
 40 oder einen bis drei, der folgenden Reste tragen können:

- C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, 1-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Alkylamino,
 45 Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₆-Halogenalkenyloxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₂-C₆-Halogenalkinyloxy, C₃-C₆-Cyclo-

alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyloxy, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl-oxy,

oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ring-
5 system, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoff-
atome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder
Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ring-
glieder enthalten kann (wie vorstehend genannt), welches direkt
oder über ein Sauerstoffatom (-O-), ein Schwefelatom (-S-) oder
10 eine Aminogruppe (-NR^a-) an den Substituenten gebunden sein kann,
d.h.

Arylreste wie Phenyl und Naphthyl, vorzugsweise Phenyl oder 1-
oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste, beispielsweise 5-Ring Hetero-
15 aromaten enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein
Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl,
3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl,
4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl,
5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazo-
20 ly, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazo-
lyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl,
1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadia-
zol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl, 1,2,3-Tri-
azol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 5-Tetrazolyl,
25 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatriazol-5-yl, insbeson-
dere 3-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 4-Oxazolyl, 4-Thiazolyl,
1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl;

Sechsring Heteroaromaten enthaltend ein bis vier Stickstoffatome
30 als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl,
3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl,
5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Tri-
azin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl,
3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyra-
35 zinyl und 4-Pyridazinyl.

Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf die cyclischen (gesättigten,
ungesättigten oder aromatischen) Gruppen soll zum Ausdruck
bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert
40 sein können (d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können
teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene
Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor
und Brom, insbesondere Fluor und Chlor) ersetzt sein können und/
oder einen bis drei, der folgenden Reste tragen können:

19

Die bei den Resten genannten ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein, d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können partiell oder vollständig durch Halogenatome wie 5 Fluor, Chlor, Brom und Jod, vorzugsweise Fluor und Chlor ersetzt sein.

Diese ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können neben den bezeichneten Halogenatomen ein bis drei 10 der folgenden Substituenten tragen:

Nitro;

Cyano, Thiocyanato;

15

Alkyl, besonders C₁-C₆-Alkyl wie vorstehend genannt, vorzugsweise Methyl, Ethyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, Butyl, Hexyl, insbesondere Methyl und 1-Methylethyl;

20 C₁-C₄-Halogenalkyl, wie vorstehend genannt, vorzugsweise Trichloromethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl und Pentafluorethyl;

C₁-C₄-Alkoxy, vorzugsweise Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 25 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy;

C₁-C₄-Halogenalkoxy, besonders C₁-C₂-Halogenalkoxy, vorzugsweise Difluormethyloxy, Trifluormethyloxy und 2,2,2-Trifluorethyloxy, insbesondere Difluormethyloxy;

30

C₁-C₄-Alkylthio, vorzugsweise Methylthio und 1-Methylethylthio, insbesondere Methylthio;

C₁-C₄-Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino, Propylamino, 35 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino, 2-Methylpropylamino und 1,1-Dimethylethylamino, vorzugsweise Methylamino und 1,1-Dimethylethylamino, insbesondere Methylamino,

Di-C₁-C₄-alkylamino wie N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, 40 N,N-Dipropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino,

20

N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propyl-amino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propyl-amino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-

5 N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino, N-Bu-tyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methyl-

10 propyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, vorzugsweise N,N-Dimethylamino und N,N-Diethylamino, insbesondere N,N-Dimethylamino;

C₁-C₆-Alkylcarbonyl wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Propyl-

15 carbonyl, 1-Methylethyl-carbonyl, Butylcarbonyl, 1-Methylpropyl-carbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl, 1,1-Dimethylethylcarbonyl, Pentylcarbonyl, 1-Methylbutylcarbonyl, 2-Methylbutylcarbonyl, 3-Methylbutylcarbonyl, 1,1-Dimethylpropylcarbonyl, 1,2-Dimethyl-propylcarbonyl, 2,2-Dimethylpropylcarbonyl, 1-Ethylpropyl-

20 carbonyl, Hexylcarbonyl, 1-Methylpentylcarbonyl, 2-Methylpentyl-carbonyl, 3-Methylpentylcarbonyl, 4-Methylpentylcarbonyl, 1,1-Dimethylbutylcarbonyl, 1,2-Dimethylbutylcarbonyl, 1,3-Dimethylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylbutylcarbonyl, 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl, 1-Ethyl-

25 butylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropyl-carbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl-carbonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl, vorzugsweise Methyl-carbonyl, Ethylcarbonyl und 1,1-Dimethylcarbonyl, insbesondere Ethylcarbonyl;

30

C₁-C₆-Alkoxy carbonyl wie Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propyl-oxycarbonyl, 1-Methyl-ethoxycarbonyl, Butyloxy carbonyl, 1-Methyl-propyloxy carbonyl, 2-Methylpropyloxy carbonyl, 1,1-Dimethylethoxy-carbonyl, Pentyloxy carbonyl, 1-Methylbutyloxy carbonyl, 2-Methyl-

35 butyloxy carbonyl, 3-Methylbutyloxy carbonyl, 2,2-Dimethylpropyl-oxycarbonyl, 1-Ethylpropyloxy carbonyl, Hexyloxy carbonyl, 1,1-Di-methylpropoxy carbonyl, 1,2-Dimethylpropyloxy carbonyl, 1-Methyl-pentyloxy carbonyl, 2-Methylpentyloxy carbonyl, 3-Methylpentyloxy-carbonyl, 4-Methylpentyloxy carbonyl, 1,1-Dimethylbutyloxy carbo-

40 nyl, 1,2-Dimethylbutyloxy carbonyl, 1,3-Dimethylbutyloxy carbonyl, 2,2-Dimethylbutyloxy carbonyl, 2,3-Dimethylbutyloxy carbonyl, 3,3-Dimethylbutyloxy carbonyl, 1-Ethylbutyloxy carbonyl, 2-Ethyl-butyloxy carbonyl, 1,1,2-Trimethylpropyloxy carbonyl, 1,2,2-Tri-methylpropyloxy carbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropyloxy carbonyl und

45 1-Ethyl-2-methylpropyloxy carbonyl, vorzugsweise Methoxycarbonyl,

21

Ethoxycarbonyl und 1,1-Dimethylethoxycarbonyl, insbesondere Ethoxycarbonyl;

C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl wie Methylaminocarbonyl, Ethylamino-
 5 carbonyl, Propylaminocarbonyl, 1-Methylethylaminocarbonyl, Butyl-
 aminocarbonyl, 1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylamino-
 carbonyl, 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl, Pentylaminocarbonyl,
 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methylbutylaminocarbonyl, 3-Methyl-
 butylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethylpro-
 10 pylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylpropylamino-
 carbonyl, 1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylamino-
 carbonyl, 2-Methylpentylaminocarbonyl, 3-Methylpentylamino-
 carbonyl, 4-Methylpentylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylbutylamino-
 carbonyl, 1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,3-Dimethylbutylamino-
 15 carbonyl, 2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,3-Dimethylbutylamino-
 carbonyl, 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocar-
 bonyl, 2-Ethylbutylaminocarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylaminocar-
 bonyl, 1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpro-
 pylaminocarbonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylaminocarbonyl, vor-
 20 zugsweise Methylaminocarbonyl und Ethylaminocarbonyl, insbesondere
 Methylaminocarbonyl;

Di-C₁-C₆-alkylaminocarbonyl, besonders Di-C₁-C₄-alkylaminocarbonyl
 wie N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl, N,N-Di-
 25 propylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N,N-Di-
 butylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-
 (2-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-amino-
 carbonyl, N-Ethyl-N-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-propylamino-
 carbonyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-
 30 methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl,
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-
 N-methylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl, N-Ethyl-
 N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methyl-
 35 propyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl,
 N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-propylamino-
 carbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(2-Methyl-
 propyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propyl-
 aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl,
 40 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1-Methyl-
 ethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Di-methylethyl)-
 N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino-
 carbonyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Butyl-
 N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-
 45 N-(2-methyl-propyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-
 N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl und N-(1,1-Dimethylethyl)-
 N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, vorzugsweise N,N-Dimethylamino-

22

carbonyl und N,N-Diethylamincarbonyl, insbesondere N,N-Dimethylaminocarbonyl;

C₁-C₆-Alkylcarboxyl wie Methylcarboxyl, Ethylcarboxyl, Propylcarboxyl, 1-Methylethylcarboxyl, Butylcarboxyl, 1-Methylpropylcarboxyl, 2-Methylpropylcarboxyl, 1,1-Dimethylethylcarboxyl, Pentylcarboxyl, 1-Methylbutylcarboxyl, 2-Methylbutylcarboxyl, 3-Methylbutylcarboxyl, 1,1-Dimethylpropylcarboxyl, 1,2-Dimethylpropylcarboxyl, 2,2-Dimethylpropylcarboxyl, 1-Ethylpropylcarboxyl, Hexylcarboxyl, 1-Methylpentylcarboxyl, 2-Methylpentylcarboxyl, 3-Methylpentylcarboxyl, 4-Methylpentylcarboxyl, 1,1-Dimethylbutylcarboxyl, 1,2-Dimethylbutylcarboxyl, 1,3-Dimethylbutylcarboxyl, 2,2-Dimethylbutylcarboxyl, 2,3-Dimethylbutylcarboxyl, 3,3-Dimethylbutylcarboxyl, 1-Ethylbutylcarboxyl, 2-Ethylbutylcarboxyl, 1,1,2-Trimethylpropylcarboxyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarboxyl, 1-Ethyl-1-methylpropylcarboxyl und 1-Ethyl-2-methylpropylcarboxyl, vorzugsweise Methylcarboxyl, Ethylcarboxyl und 1,1-Dimethylethylcarbonyl, insbesondere Methylcarboxyl und 1,1-Dimethylethylcarboxyl;

20

C₁-C₆-Alkylcarbonylamino wie Methylcarbonylamino, Ethylcarbonylamino, Propylcarbonylamino, 1-Methylethylcarbonylamino, Butylcarbonylamino, 1-Methylpropylcarbonylamino, 2-Methylpropylcarbonylamino, 1,1-Dimethylethylcarbonylamino, Pentylcarbonylamino, 1-Methylbutylcarbonylamino, 2-Methylbutylcarbonylamino, 3-Methylbutylcarbonylamino, 2,2-Dimethylpropylcarbonylamino, 1-Ethylpropylcarbonylamino, Hexylcarbonylamino, 1,1-Dimethylpropylcarbonylamino, 1,2-Dimethylpropylcarbonylamino, 1-Methylpentylcarbonylamino, 2-Methylpentylcarbonylamino, 3-Methylpentylcarbonylamino, 4-Methylpentylcarbonylamino, 1,1-Dimethylbutylcarbonylamino, 1,2-Dimethylbutylcarbonylamino, 1,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 2,2-Dimethylbutylcarbonylamino, 2,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 3,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 1-Ethylbutylcarbonylamino, 2-Ethylbutylcarbonylamino, 1,1,2-Trimethylpropylcarbonylamino, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonylamino, 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonylamino und 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonylamino, vorzugsweise Methylcarbonylamino und Ethylcarbonylamino, insbesondere Ethylcarbonylamino;

40 C₃-C₇-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl, vorzugsweise Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, insbesondere Cyclopropyl;

C₃-C₇-Cycloalkoxy wie Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyl-
45 oxy, Cyclohexyloxy und Cycloheptyloxy, vorzugsweise Cyclopentyl-
oxy und Cyclohexyloxy, insbesondere Cyclohexyloxy;

23

C₃-C₇-Cycloalkylthio wie Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio und Cycloheptylthio, vorzugsweise Cyclohexylthio;

5 C₃-C₇-Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino und Cycloheptylamino, vorzugsweise Cyclopropylamino und Cyclohexylamino, insbesondere Cyclopropylamino;

10 Zwei benachbarte Reste an R³ können die Bedeutung einer, gegebenenfalls mit Fluor substituierte Oxy-C₁-C₂-alkylidenoxy-Kette, wie z.B. -O-CH₂-O-, -O-CF₂-O-, -O-CH₂CH₂-O- oder -O-CF₂CF₂-O-, oder einer C₃-C₄-Alkylidenkette, wie z.B. Propyliden oder Butyliden, haben.

15

Die ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können neben den vorstehend genannten Substituenten auch einen Rest -CR'-NOR" tragen, wobei die Reste R' und R" für die folgenden Gruppen stehen:

20

R' Wasserstoff, Cyano, Alkyl (vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, insbesondere C₁-C₄-Alkyl), Haloalkyl (vorzugsweise C₁-C₄-Haloalkyl, insbesondere C₁-C₂-Haloalkyl), Alkenyl (vorzugsweise C₂-C₆-Alkenyl, insbesondere C₂-C₄-Alkenyl), Haloalkenyl (vorzugsweise C₂-C₆-Haloalkenyl, insbesondere C₂-C₄-Haloalkenyl), Alkynyl (vorzugsweise C₂-C₆-Alkynyl, insbesondere C₂-C₄-Alkynyl), Haloalkynyl (vorzugsweise C₂-C₆-Haloalkynyl, insbesondere C₂-C₄-Haloalkynyl) und Cycloalkyl (vorzugsweise C₃-C₈-Cycloalkyl, insbesondere C₃-C₆-Cycloalkyl);

30

R" Alkyl (vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl, insbesondere C₁-C₄-Alkyl), Haloalkyl (vorzugsweise C₁-C₄-Haloalkyl, insbesondere C₁-C₂-Haloalkyl), Alkenyl (vorzugsweise C₂-C₆-Alkenyl, insbesondere C₂-C₄-Alkenyl), Haloalkenyl (vorzugsweise C₂-C₆-Haloalkenyl, insbesondere C₂-C₄-Haloalkenyl), Alkynyl (vorzugsweise C₂-C₆-Alkynyl, insbesondere C₂-C₄-Alkynyl), Haloalkynyl (vorzugsweise C₂-C₆-Haloalkynyl, insbesondere C₂-C₄-Haloalkynyl) und Cycloalkyl (vorzugsweise C₃-C₈-Cycloalkyl, insbesondere C₃-C₆-Cycloalkyl).

40

Im Hinblick auf ihre biologische Wirkung sind Verbindungen I bevorzugt, in denen n für 0 oder 1, insbesondere für 0, steht.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für Halogen,

45 C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht.

24

Gleichermaßen werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² Nitro, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl steht.

- 5 Des weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl steht.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für einen ggf. subst. ein- oder zweikernigen aromatischen Rest steht, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann.

- 15 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R³ für Phenyl oder Benzyl steht, wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder

- 20 - ein bis drei der folgenden Reste: Cyano, Nitro, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Phenylringe ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis
- 25 drei der folgenden Reste tragen können: Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, und/oder
- 30 - eine Gruppe CR'=NOR'', in der R' Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet und R'' für C₁-C₆-Alkyl steht, und/oder
- zwei benachbarte C-Atome des Phenylrings über eine
- 35 Oxy-C₁-C₃-alkoxy-Brücke oder eine Oxy-C₁-C₃-halogenalkoxy-Brücke

tragen kann.

- Außerdem werden Verbindungen I insbesondere bevorzugt, in denen R³
- 40 für Pyridyl oder Pyrimidyl steht, wobei der heteroaromatische Ring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl.

25

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl steht.

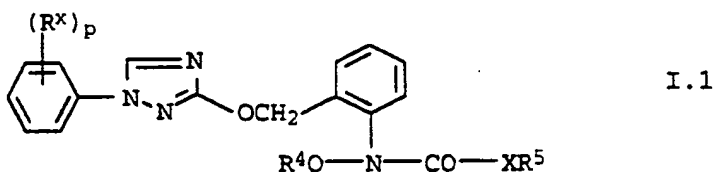
Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^5X für Methyl, 5 Ethyl, Cyclopropyl, Methoxy oder Methylamino steht.

Beispiele für insbesondere bevorzugte Verbindungen I sind in den Tabellen zusammengestellt.

10 Tabelle 1

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

15



20

Tabelle 2

25

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Ethyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 3

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methoxy bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 4

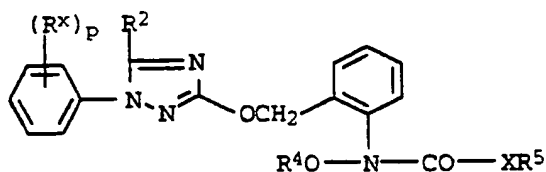
Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methylamino bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer

40 Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl 45 steht, R^5X Methyl bedeutet, R^2 Methyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

26



I.2

5

Tabelle 6

10

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 7

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 8

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 9

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 10

35 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 11

40

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

27

Tabelle 12

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Chlor bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Chlor bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Chlor bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 16

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Chlor bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 17

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Brom bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Brom bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

28

Tabelle 19

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für eine
5 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl
10 steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 22

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Ethyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 23

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methoxy bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 24

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methylamino bedeutet und R^X_p für eine Verbindung
35 einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methyl bedeutet, R^2 Methyl bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

29

Tabelle 26

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 27

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 28

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Methyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 29

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 30

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 31

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 32

Tabelle 32

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Ethyl bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 33

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Chlor bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 34

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Ethyl bedeutet, R^2 Chlor bedeutet und R^X_p für
5 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht
Tabelle 35

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^2 Chlor bedeutet und R^X_p für
10 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^2 Chlor bedeutet und R^X_p für
15 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methyl bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

25 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Ethyl bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 39

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für
35 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 40

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^2 Brom bedeutet und R^X_p für
40 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

31

Tabelle 41

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁵X Methyl bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

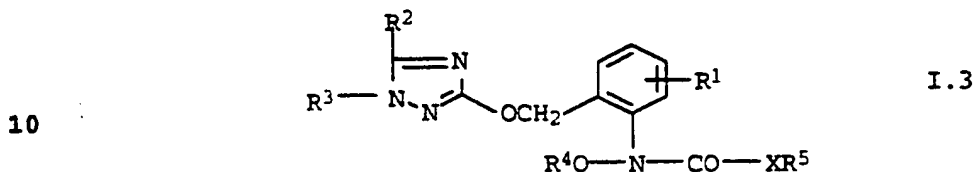


Tabelle 42

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁵X Ethyl bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

Tabelle 43

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁵X Methoxy bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

25 Tabelle 44

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁵X Methylamino bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R², R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

30 spricht

Tabelle 45

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Cyano bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 46

40 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Cyano bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

32

Tabelle 47

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Cyano bedeutet und R^x_p für eine
5 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 48

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl
10 steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Cyano bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 49

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Methoxy bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 50

20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Methoxy bedeutet und R^x_p für eine
Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 51

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Methoxy bedeutet und R^x_p für eine
Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 52

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Methoxy bedeutet und R^x_p für
35 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 53

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl
40 steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² Ethoxy bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

33

Tabelle 54

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² Ethoxy bedeutet und R^x_p für eine
5 Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 55

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl
10 steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² Ethoxy bedeutet und R^x_p für eine
Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 56

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² Ethoxy bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 57

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R² n-Propoxy bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

25 Tabelle 58

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R² n-Propoxy bedeutet und R^x_p für eine
Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 59

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R² n-Propoxy bedeutet und R^x_p für
35 eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 60

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl
40 steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R² n-Propoxy bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

34

Tabelle 61

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methyl bedeutet, R^2 CF_3 bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 62

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Ethyl bedeutet, R^2 CF_3 bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 63

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^2 CF_3 bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 64

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^2 CF_3 bedeutet und R^x_p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

30

35

40

45

Tabelle A

	Nr.	R ^x _p
5	12	H
	13	2-F
	14	3-F
	15	4-F
10	16	2,4-F ₂
	17	2,4,6-F ₃
	18	2,3,4,5,6-F ₅
	19	2,3-F ₂
15	20	2-Cl
	21	3-Cl
	22	4-Cl
	23	2,3-Cl ₂
20	24	2,4-Cl ₂
	25	2,5-Cl ₂
	26	2,6-Cl ₂
	27	3,4-Cl ₂
25	28	3,5-Cl ₂
	29	2,3,4-Cl ₃
	30	2,3,5-Cl ₃
	31	2,3,6-Cl ₃
30	32	2,4,5-Cl ₃
	33	2,4,6-Cl ₃
	34	3,4,5-Cl ₃
	35	2,3,4,6-Cl ₄
35	36	2,3,5,6-Cl ₄
	37	2,3,4,5,6-Cl ₅
	38	2-Br
	39	3-Br
40	40	4-Br
	41	2,4-Br ₂
	42	2,5-Br ₂
	43	2,6-Br ₂
45	44	2,4,6-Br ₃
	45	2,3,4,5,6-Br ₅
	46	2-J

	Nr.	R ^x _p
	47	3-J
	48	4-J
5	49	2,4-J ₂
	50	2-Cl, 3-F
	51	2-Cl, 4-F
	52	2-Cl, 5-F
10	53	2-Cl, 6-F
	54	2-Cl, 3-Br
	55	2-Cl, 4-Br
	56	2-Cl, 5-Br
15	57	2-Cl, 6-Br
	58	2-Br, 3-Cl
	59	2-Br, 4-Cl
	60	2-Br, 5-Cl
20	61	2-Br, 3-F
	62	2-Br, 4-F
	63	2-Br, 5-F
	64	2-Br, 6-F
25	65	2-F, 3-Cl
	66	2-F, 4-Cl
	67	2-F, 5-Cl
	68	3-Cl, 4-F
30	69	3-Cl, 5-F
	70	3-Cl, 4-Br
	71	3-Cl, 5-Br
	72	3-F, 4-Cl
35	73	3-F, 4-Br
	74	3-Br, 4-Cl
	75	3-Br, 4-F
	76	2,6-Cl ₂ , 4-Br
40	77	2-CH ₃
	78	3-CH ₃
	79	4-CH ₃
	80	2,3-(CH ₃) ₂
45	81	2,4-(CH ₃) ₂
	82	2,5-(CH ₃) ₂
	83	2,6-(CH ₃) ₂

Nr.	R ^x _p
84	3,4-(CH ₃) ₂
85	3,5-(CH ₃) ₂
5 86	2,3,5-(CH ₃) ₃
87	2,3,4-(CH ₃) ₃
88	2,3,6-(CH ₃) ₃
89	2,4,5-(CH ₃) ₃
10 90	2,4,6-(CH ₃) ₃
91	3,4,5-(CH ₃) ₃
92	2,3,4,6-(CH ₃) ₄
93	2,3,5,6-(CH ₃) ₄
15 94	2,3,4,5,6-(CH ₃) ₅
95	2-C ₂ H ₅
96	3-C ₂ H ₅
97	4-C ₂ H ₅
20 98	2,4-(C ₂ H ₅) ₂
99	2,6-(C ₂ H ₅) ₂
100	3,5-(C ₂ H ₅) ₂
101	2,4,6-(C ₂ H ₅) ₃
25 102	2-n-C ₃ H ₇
103	3-n-C ₃ H ₇
104	4-n-C ₃ H ₇
105	2-i-C ₃ H ₇
30 106	3-i-C ₃ H ₇
107	4-i-C ₃ H ₇
108	2,4-(i-C ₃ H ₇) ₂
109	2,6-(i-C ₃ H ₇) ₂
35 110	3,5-(i-C ₃ H ₇) ₂
111	2-s-C ₄ H ₉
112	3-s-C ₄ H ₉
113	4-s-C ₄ H ₉
40 114	2-t-C ₄ H ₉
115	3-t-C ₄ H ₉
116	4-t-C ₄ H ₉
117	4-n-C ₉ H ₁₉
45 118	2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉
119	2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉
120	2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇

	Nr.	R ^x _p
	121	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇
	122	3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
5	123	2-cyclo-C ₆ H ₁₁
	124	3-cyclo-C ₆ H ₁₁
	125	4-cyclo-C ₆ H ₁₁
	126	2-Cl, 4-C ₆ H ₅
10	127	2-Br, 4-C ₆ H ₅
	128	2-OCH ₃
	129	3-OCH ₃
	130	4-OCH ₃
15	131	2-OC ₂ H ₅
	132	3-O-C ₂ H ₅
	133	4-O-C ₂ H ₅
	134	2-O-n-C ₃ H ₇
20	135	3-O-n-C ₃ H ₇
	136	4-O-n-C ₃ H ₇
	137	2-O-i-C ₃ H ₇
	138	3-O-i-C ₃ H ₇
25	139	4-O-i-C ₃ H ₇
	140	2-O-n-C ₆ H ₁₃
	141	3-O-n-C ₆ H ₁₃
	142	4-O-n-C ₆ H ₁₃
30	143	2-O-CH ₂ C ₆ H ₅
	144	3-O-CH ₂ C ₆ H ₅
	145	4-O-CH ₂ C ₆ H ₅
	146	2-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
35	147	4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
	148	2,3-(OCH ₃) ₂
	149	2,4-(OCH ₃) ₂
	150	2,5-(OCH ₃) ₂
40	151	2,6-(OCH ₃) ₂
	152	3,4-(OCH ₃) ₂
	153	3,5-(OCH ₃) ₂
	154	2-O-t-C ₄ H ₉
45	155	3-O-t-C ₄ H ₉
	156	4-O-t-C ₄ H ₉
	157	3-(3'-Cl-C ₆ H ₄)

Nr.	R ^x _p
158	4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
159	2-O-C ₆ H ₅
5 160	3-O-C ₆ H ₅
161	4-O-C ₆ H ₅
162	2-O-(2'-F-C ₆ H ₄)
163	3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
10 164	4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
165	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F
166	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl
167	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br
15 168	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-F
169	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Cl
170	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Br
171	2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃
20 172	2-Cl, 4-NO ₂
173	2-NO ₂ , 4-Cl
174	2-OCH ₃ , 5-NO ₂
175	2,4-Cl ₂ , 5-NO ₂
25 176	2,4-Cl ₂ , 6-NO ₂
177	2,6-Cl ₂ , 4-NO ₂
178	2,6-Br ₂ , 4-NO ₂
179	2,6-J ₂ , 4-NO ₂
30 180	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl
181	2-CO ₂ CH ₃
182	3-CO ₂ CH ₃
183	4-CO ₂ CH ₃
35 184	2-CH ₂ -OCH ₃
185	3-CH ₂ -OCH ₃
186	4-CH ₂ -OCH ₃
187	2-Me-4-CH ₃ -CH(CH ₃)-CO
40 188	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
189	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
190	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)
191	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
45 192	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
193	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
194	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)

	Nr.	R ^x _p
	195	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
	196	2-C ₆ H ₅
5	197	3-C ₆ H ₅
	198	4-C ₆ H ₅
	199	2-(2'-F-C ₆ H ₄)
	200	2-CH ₃ , 5-Br
10	201	2-CH ₃ , 6-Br
	202	2-Cl, 3-CH ₃
	203	2-Cl, 4-CH ₃
	204	2-Cl, 5-CH ₃
15	205	2-F, 3-CH ₃
	206	2-F, 4-CH ₃
	207	2-F, 5-CH ₃
	208	2-Br, 3-CH ₃
20	209	2-Br, 4-CH ₃
	210	2-Br, 5-CH ₃
	211	3-CH ₃ , 4-Cl
	212	3-CH ₃ , 5-Cl
25	213	3-CH ₃ , 4-F
	214	3-CH ₃ , 5-F
	215	3-CH ₃ , 4-Br
	216	3-CH ₃ , 5-Br
30	217	3-F, 4-CH ₃
	218	3-Cl, 4-CH ₃
	219	3-Br, 4-CH ₃
	220	2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂
35	221	2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂
	222	2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂
	223	2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂
	224	2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃
40	225	2,6-F ₂ , 4-CH ₃
	226	2,6-Br ₂ , 4-CH ₃
	227	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
	228	2,4-F ₂ , 6-CH ₃
	229	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
45	230	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-F
	231	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Cl

41

Nr.	R ^x _P
232	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Br
233	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-F
5 234	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
235	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Br
236	2-CF ₃
237	3-CF ₃
10 238	4-CF ₃
239	2-OCF ₃
240	3-OCF ₃
241	4-OCF ₃
15 242	3-OCH ₂ CHF ₂
243	2-NO ₂
244	3-NO ₂
245	4-NO ₂
20 246	2-CN
247	3-CN
248	4-CN
249	2-CH ₃ , 3-Cl
25 250	2-CH ₃ , 4-Cl
251	2-CH ₃ , 5-Cl
252	2-CH ₃ , 6-Cl
253	2-CH ₃ , 3-F
30 254	2-CH ₃ , 4-F
255	2-CH ₃ , 5-F
256	2-CH ₃ , 6-F
257	2-CH ₃ , 3-Br
35 258	2-CH ₃ , 4-Br
259	2-Pyridyl-2'
260	3-Pyridyl-3'
261	4-Pyridyl-4'

40

45

Tabelle B

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
5	1	H	H	Cyclohexyl	CH ₃
	2	H	H	Benzyl	CH ₃
	3	H	H	2-Pyridyl	CH ₃
	4	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	5	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
10	6	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
	7	H	Cl	Cyclohexyl	CH ₃
15	8	H	Cl	Benzyl	CH ₃
	9	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
	10	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	11	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	12	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
20	13	H	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₃
	14	H	CH ₃	Benzyl	CH ₃
	15	H	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₃
	16	H	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	17	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
25	18	H	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₃
	19	H	H	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
30	20	H	H	Benzyl	C ₂ H ₅
	21	H	H	Phenyl	C ₂ H ₅
	22	H	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
	23	H	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	24	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
35	25	H	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	26	H	Cl	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	27	H	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
	28	H	Cl	Phenyl	C ₂ H ₅
	29	H	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
40	30	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	31	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
	32	H	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	33	H	CH ₃	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	34	H	CH ₃	Benzyl	C ₂ H ₅
45	35	H	CH ₃	Phenyl	C ₂ H ₅
	36	H	CH ₃	2-Pyridyl	C ₂ H ₅

43

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
37	H	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
38	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
5 39	H	CH ₃	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
40	H	H	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
41	H	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
42	H	H	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
10 43	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
44	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
45	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
46	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
15 47	H	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
48	H	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
49	H	Cl	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
50	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
20 51	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
52	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
53	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
54	H	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
25 55	H	CH ₃	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
56	H	CH ₃	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
57	H	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
58	H	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
30 59	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
60	H	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
61	H	H	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
62	H	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
35 63	H	H	Phenyl	CH ₂ C≡CH
64	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
65	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
66	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
40 67	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
68	H	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
69	H	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
70	H	Cl	Phenyl	CH ₂ C≡CH
45 71	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
72	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
73	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	74	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	75	H	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
5	76	H	CH ₃	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	77	H	CH ₃	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	78	H	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	79	H	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
10	80	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	81	H	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	82	3-F	H	Cyclohexyl	CH ₃
	83	3-F	H	Benzyl	CH ₃
15	84	3-F	H	Phenyl	CH ₃
	85	3-F	H	2-Pyridyl	CH ₃
	86	3-F	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	87	3-F	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
20	88	3-F	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
	89	3-F	Cl	Cyclohexyl	CH ₃
	90	3-F	Cl	Benzyl	CH ₃
	91	3-F	Cl	Phenyl	CH ₃
25	92	3-F	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
	93	3-F	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	94	3-F	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	95	3-F	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
30	96	3-F	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₃
	97	3-F	CH ₃	Benzyl	CH ₃
	98	3-F	CH ₃	Phenyl	CH ₃
	99	3-F	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₃
35	100	3-F	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	101	3-F	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	102	3-F	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₃
	103	3-F	H	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
40	104	3-F	H	Benzyl	C ₂ H ₅
	105	3-F	H	Phenyl	C ₂ H ₅
	106	3-F	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
	107	3-F	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	108	3-F	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
45	109	3-F	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	110	3-F	Cl	Cyclohexyl	C ₂ H ₅

45

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	111	3-F	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
	112	3-F	Cl	Phenyl	C ₂ H ₅
5	113	3-F	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
	114	3-F	Cl	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	115	3-F	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
	116	3-F	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
10	117	3-F	CH ₃	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	118	3-F	CH ₃	Benzyl	C ₂ H ₅
	119	3-F	CH ₃	Phenyl	C ₂ H ₅
	120	3-F	CH ₃	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
15	121	3-F	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	122	3-F	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
	123	3-F	CH ₃	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	124	3-F	H	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
20	125	3-F	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
	126	3-F	H	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
	127	3-F	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
	128	3-F	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
25	129	3-F	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	130	3-F	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
	131	3-F	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
	132	3-F	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
30	133	3-F	Cl	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
	134	3-F	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
	135	3-F	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	136	3-F	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
35	137	3-F	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
	138	3-F	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
	139	3-F	CH ₃	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
	140	3-F	CH ₃	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
40	141	3-F	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
	142	3-F	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	143	3-F	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	144	3-F	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
45	145	3-F	H	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	146	3-F	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	147	3-F	H	Phenyl	CH ₂ C≡CH

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	148	3-F	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	149	3-F	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
5	150	3-F	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	151	3-F	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	152	3-F	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	153	3-F	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
10	154	3-F	Cl	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	155	3-F	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	156	3-F	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	157	3-F	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
15	158	3-F	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	159	3-F	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	160	3-F	CH ₃	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	161	3-F	CH ₃	Phenyl	CH ₂ C≡CH
20	162	3-F	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	163	3-F	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	164	3-F	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	165	3-F	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
25	166	6-Cl	H	Cyclohexyl	CH ₃
	167	6-Cl	H	Benzyl	CH ₃
	168	6-Cl	H	Phenyl	CH ₃
	169	6-Cl	H	2-Pyridyl	CH ₃
30	170	6-Cl	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	171	6-Cl	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	172	6-Cl	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
	173	6-Cl	Cl	Cyclohexyl	CH ₃
35	174	6-Cl	Cl	Benzyl	CH ₃
	175	6-Cl	Cl	Phenyl	CH ₃
	176	6-Cl	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
	177	6-Cl	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
40	178	6-Cl	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	179	6-Cl	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
	180	6-Cl	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₃
	181	6-Cl	CH ₃	Benzyl	CH ₃
45	182	6-Cl	CH ₃	Phenyl	CH ₃
	183	6-Cl	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₃
	184	6-Cl	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
185	6-Cl	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
186	6-Cl	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₃
5 187	6-Cl	H	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
188	6-Cl	H	Benzyl	C ₂ H ₅
189	6-Cl	H	Phenyl	C ₂ H ₅
190	6-Cl	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
10 191	6-Cl	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
192	6-Cl	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
193	6-Cl	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
194	6-Cl	Cl	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
15 195	6-Cl	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
196	6-Cl	Cl	Phenyl	C ₂ H ₅
197	6-Cl	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
198	6-Cl	Cl	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
20 199	6-Cl	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
200	6-Cl	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
201	6-Cl	CH ₃	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
202	6-Cl	CH ₃	Benzyl	C ₂ H ₅
25 203	6-Cl	CH ₃	Phenyl	C ₂ H ₅
204	6-Cl	CH ₃	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
205	6-Cl	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
206	6-Cl	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
30 207	6-Cl	CH ₃	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
208	6-Cl	H	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
209	6-Cl	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
210	6-Cl	H	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
35 211	6-Cl	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
212	6-Cl	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
213	6-Cl	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
214	6-Cl	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
40 215	6-Cl	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
216	6-Cl	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
217	6-Cl	Cl	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
218	6-Cl	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
45 219	6-Cl	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
220	6-Cl	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
221	6-Cl	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	222	6-Cl	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
	223	6-Cl	CH ₃	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
5	224	6-Cl	CH ₃	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
	225	6-Cl	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
	226	6-Cl	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	227	6-Cl	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
10	228	6-Cl	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
	229	6-Cl	H	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	230	6-Cl	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	231	6-Cl	H	Phenyl	CH ₂ C≡CH
15	232	6-Cl	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	233	6-Cl	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	234	6-Cl	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	235	6-Cl	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
20	236	6-Cl	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	237	6-Cl	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	238	6-Cl	Cl	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	239	6-Cl	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
25	240	6-Cl	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	241	6-Cl	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	242	6-Cl	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	243	6-Cl	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
30	244	6-Cl	CH ₃	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	245	6-Cl	CH ₃	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	246	6-Cl	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	247	6-Cl	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
35	248	6-Cl	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	249	6-Cl	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	250	6-CH ₃	H	Cyclohexyl	CH ₃
	251	6-CH ₃	H	Benzyl	CH ₃
40	252	6-CH ₃	H	Phenyl	CH ₃
	253	6-CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₃
	254	6-CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	255	6-CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
45	256	6-CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
	257	6-CH ₃	Cl	Cyclohexyl	CH ₃
	258	6-CH ₃	Cl	Benzyl	CH ₃

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	259	6-CH ₃	Cl	Phenyl	CH ₃
	260	6-CH ₃	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
5	261	6-CH ₃	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
	262	6-CH ₃	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	263	6-CH ₃	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
	264	6-CH ₃	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₃
10	265	6-CH ₃	CH ₃	Benzyl	CH ₃
	266	6-CH ₃	CH ₃	Phenyl	CH ₃
	267	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₃
	268	6-CH ₃	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
15	269	6-CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
	270	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₃
	271	6-CH ₃	H	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	272	6-CH ₃	H	Benzyl	C ₂ H ₅
20	273	6-CH ₃	H	Phenyl	C ₂ H ₅
	274	6-CH ₃	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
	275	6-CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	276	6-CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
25	277	6-CH ₃	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	278	6-CH ₃	Cl	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	279	6-CH ₃	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
	280	6-CH ₃	Cl	Phenyl	C ₂ H ₅
30	281	6-CH ₃	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
	282	6-CH ₃	Cl	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	283	6-CH ₃	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
	284	6-CH ₃	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
35	285	6-CH ₃	CH ₃	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
	286	6-CH ₃	CH ₃	Benzyl	C ₂ H ₅
	287	6-CH ₃	CH ₃	Phenyl	C ₂ H ₅
	288	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
40	289	6-CH ₃	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
	290	6-CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
	291	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
	292	6-CH ₃	H	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
45	293	6-CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
	294	6-CH ₃	H	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
	295	6-CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃

50

	Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
	296	6-CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	297	6-CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
5	298	6-CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
	299	6-CH ₃	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
	300	6-CH ₃	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
	301	6-CH ₃	Cl	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
10	302	6-CH ₃	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
	303	6-CH ₃	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	304	6-CH ₃	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	305	6-CH ₃	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
15	306	6-CH ₃	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ OCH ₃
	307	6-CH ₃	CH ₃	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
	308	6-CH ₃	CH ₃	Phenyl	CH ₂ OCH ₃
	309	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
20	310	6-CH ₃	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	311	6-CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
	312	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
	313	6-CH ₃	H	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
25	314	6-CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	315	6-CH ₃	H	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	316	6-CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	317	6-CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
30	318	6-CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	319	6-CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
	320	6-CH ₃	Cl	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	321	6-CH ₃	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
35	322	6-CH ₃	Cl	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	323	6-CH ₃	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
	324	6-CH ₃	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	325	6-CH ₃	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
	326	6-CH ₃	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
40	327	6-CH ₃	CH ₃	Cyclohexyl	CH ₂ C≡CH
	328	6-CH ₃	CH ₃	Benzyl	CH ₂ C≡CH
	329	6-CH ₃	CH ₃	Phenyl	CH ₂ C≡CH
	330	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
45	331	6-CH ₃	CH ₃	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH

51

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
332	6-CH ₃	CH ₃	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
333	6-CH ₃	CH ₃	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH

- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I eignen sich zur Bekämpfung von Schadpilzen und von tierischen Schädlingen aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veteri-
- 10 närsektor als Fungizide und Schädlingsbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Zu den schädlichen Insekten gehören:

- 15 aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise Adoxophyes orana, Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyresthia conjugella, Autographa gamma, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Chilo partellus, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cnaphalocrocis medinalis, Crocidolomia binotalis, Cy-
- 20 dia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Feltia subterranea, Grapholitha funebrana, Grapholitha molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea,
- 25 Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera scitella, Lithocolletis blanchardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Manduca sexta, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Operophtera brumata, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Pandemis hep-
- 30 rana, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scabra, Platynota stultana, Plutella xylostella, Prays citri,
- 35 Prays oleae, Prodenia sunia, Prodenia ornithogalli, Pseudoplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sesamia inferens, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Syllepta derogata, Synanthedon myopaeformis, Thaumetopoea pityocampa, Tortrix viridana, Tri-
- 40 choplusia ni, Tryporyza incertulas, Zeiraphera canadensis, ferner Galleria mellonella und Sitotroga cerealella, Ephestia cautella, Tineola bisselliella;

- aus der Ordnung der Käfer (Coleoptera) beispielsweise Agriotes
- 45 lineatus, Agriotes obscurus, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Apion vorax, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorrhynchus assimilis,

52

Ceuthorrhynchus napi, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Dendroctonus refipennis*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonium californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* sp., *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Psylliodes napi*, *Scolytus intricatus*, *Sitona lineatus*, ferner *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Sitophilus granaria*, *Lasioderma serricorne*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitophilus oryzae*, *Tribolium castaneum*, *Trogoderma granarium*, *Zabrotes subfasciatus*;

aus der Ordnung der Zweiflügler (Diptera) beispielsweise *Anastrepha ludens*, *Ceratitis capitata*, *Contarinia sorghicola*, *Dacus curbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia coarctata*, *Delia radicum*, *Hydrellia griseola*, *Hylemyia platura*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Mayetiola destructor*, *Orseolia oryzae*, *Oscinella frit*, *Pegomya hyoscyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, ferner *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anopheles maculipennis*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hypoderma lineata*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Tabanus bovinus*, *Simulium damnosum*;

aus der Ordnung der Thripse (Thysanoptera) beispielsweise *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Haplothrips tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

aus der Ordnung der Hautflügler (Hymenoptera) beispielsweise *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Iridomyrmes humilis*, *Iridomyrmex purpureus*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*;

45 aus der Ordnung der Wanzen (Heteroptera) beispielsweise *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Eu-*

53

schistus impictiventris, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*;

- 5 aus der Ordnung der Pflanzensauger (Homoptera) beispielsweise *Acyrtosiphon onobrychis*, *Acyrtosiphon pisum*, *Adelges laricis*, *Aonidiella aurantii*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis gossypii*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Brachycaudus cardui*, *Brevicoryne brassicae*, *Dalbulus maidis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Empoasca fabae*, *Eriosoma lanigerum*, *Laodelphax striatella*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus cerasi*, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Planococcus citri*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Psylla pyricol*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Saissetia oleae*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Toxoptera citricida*, *Trialeurodes abutilonea*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Viteus vitifolii*;

20

aus der Ordnung der Termiten (Isoptera) beispielsweise *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Macrotermes subhyalinus*, *Odontotermes formosanus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*;

- 25 aus der Ordnung der Geradflügler (Orthoptera) beispielsweise *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus*, *Schistocerca gregaria*, ferner *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*;

- aus der Ordnung der Arachnoidea beispielsweise phytophage Milben wie *Aculops lycopersicae*, *Aculops pelekassi*, *Aculus schlechteri*, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia praetiosa*, *Eotetranychus carpini*, *Eutetranychus banksii*, *Eriophyes sheldoni*, *Oligonychus pratensis*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus urticae*, Zecken wie *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus appendiculatus* und *Rhipicephalus evertsi* sowie tierparasitische Milben wie *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis* und *Sarcoptes scabiei*;

54

aus der Klasse der Nematoden beispielsweise Wurzelgallennematoden, z.B. *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, zystenbildende Nematoden, z.B. *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, migratorische Endoparasiten und semi-endoparasitische Nematoden, z.B. *Helicotylenchus multicinctus*, *Hirschmanniella oryzae*, *Hoplolaimus* spp, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus fallax*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus vulnus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus reniformis*, *Scutellonema bradys*, *Tylenchulus semipenetrans*, Stock- und Blattnematoden z.B. *Anguina tritici*, *Aphelenchoides besseyi*, *Ditylenchus angustus*, *Ditylenchus dipsaci*, Virusvektoren, z.B. *Longidorus* spp, *Trichodorus christei*, *Trichodorus viruliferus*, *Xiphinema index*, *Xiphinema mediterraneum*.

15

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

25

Als Fungizide sind die Verbindungen der Formel I z.T. systemisch wirksam. Sie können als Blatt- und Bodenfungizide gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten eingesetzt werden.

30

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Rasen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

35

Speziell eignen sich die Verbindungen I zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

40

- * *Erysiphe graminis* (echter Mehltau) in Getreide,
- * *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 45 * *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- * *Uncinula necator* an Reben,
- * *Puccinia*-Arten an Getreide,

55

- * Rhizoctonia-Arten an Baumwolle und Rasen,
- * Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr,
- * Venturia inaequalis (Schorf) an Äpfeln,
- * Helminthosporium-Arten an Getreide,
- 5 * Septoria nodorum an Weizen,
- * Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Reben,
- * Cercospora arachidicola an Erdnüssen,
- * Pseudocercospora herpotrichoides an Weizen, Gerste,
- * Pyricularia oryzae an Reis,
- 10 * Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
- * Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- * Plasmopara viticola an Reben,
- * Alternaria-Arten an Gemüse und Obst.

- 15 Die neuen Verbindungen können auch im Materialschutz (Holzschutz) eingesetzt werden, z.B. gegen *Paecilomyces variotii*.

Sie können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten oder

- 20 Granulate. Die Anwendungsformen richten sich dabei nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der Wirkstoffe gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B.

- 25 durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfs-
lösungsmittel verwendet werden können.

30

Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon),
- 35 Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser;
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Ton-
erden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate);
- 40 - Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und
- Dispergiermittel wie Ligninsulfit-Ablaugen und Methyl-
cellulose.

45

56

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- 5 und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxy- 10 ethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-aryl-polyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen-oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkyl-ether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, 15 Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergier- 20 baren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, 25 Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge- 30 meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe herge- 35 stellt werden.

Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesium- 40 sulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe. Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zu- 45 bereitungen können in größeren Bereichen variiert werden.

57

Ganz allgemein enthalten die Mittel zwischen 0,0001 und 95 Gew.-% Wirkstoff.

Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff können mit gutem
5 Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) ausgebracht werden, wobei sogar der Wirkstoff ohne Zusätze verwendet werden kann.

Für die Anwendung als Fungizide empfehlen sich Konzentrationen zwischen 0,01 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90
10 Gew.%, Wirkstoff. Für die Anwendung als Insektizide kommen Formulierungen mit 0,0001 bis 10 Gew.%, vorzugsweise 0,01 bis 1 Gew.-% Wirkstoff, in Betracht.

Die Wirkstoffe werden normalerweise in einer Reinheit von 90 %
15 bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für solche Zubereitungen sind:

- 20 I. eine Lösung aus 90 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I und 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist;
- 25 II. eine Lösung von 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I in einer Mischung aus 80 Gew.-Teilen alkyliertem Benzol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von
30 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine Dispersion.
- 35 III. eine Lösung von 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I in einer Mischung aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von
40 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine Dispersion.
- 45 IV. eine wäßrige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, in einer Mischung aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280 °C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol

58

Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine Dispersion.

- V. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus
5 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphtalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel; durch feines Verteilen der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe;
10
- VI. eine innige Mischung aus 3 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I und 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin; dieses Stäubemittel enthält 3 Gew.-% Wirkstoff;
15
- VII. eine innige Mischung aus 30 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde; diese Aufbereitung gibt dem Wirkstoff eine gute Haftfähigkeit;
20
- VIII. eine stabile wäßrige Dispersion aus 40 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenosulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates, 2 Gew.-Teilen Kieselgel und 48 Gew.-Teilen Wasser, die weiter verdünnt werden kann;
25
- IX. eine stabile ölige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 2 Gew.-Teilen des Calciumsalzes der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gew.-Teilen Fettalkohol-polyglykol-ether, 2 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates und 68 Gew.-Teilen eines paraffinischen Mineralöls;
30
35
- X. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 10 Gew.-Teilen einer erfindungsgemäßen Verbindung I, 4 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 20 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge, 38 Gew.-Teilen Kieselsäuregel und 38 Gew.-Teilen Kaolin. Durch feines Verteilen der Mischung in 10 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
40
45

59

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Saatgüter, Pflanzen, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt.

5

Die Anwendung erfolgt vor oder nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze.

Die Aufwandmengen liegen je nach Art des gewünschten Effektes
10 zwischen 0,02 und 3 kg Wirkstoff pro ha, vorzugsweise bei 0,1 bis 1 kg/ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g, vorzugsweise 0,01 bis 10 g je Kilogramm Saat-
15 gut benötigt.

Die Aufwandmenge an Wirkstoff für die Bekämpfung von Schädlingen beträgt unter Freilandbedingungen 0,02 bis 10, vorzugsweise 0,1 bis 2,0 kg/ha Wirkstoff.

20

Die Verbindungen I, allein oder in Kombination mit Herbiziden oder Fungiziden, können auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam ausgebracht werden, beispielsweise mit Wachstumsregulatoren oder mit Mitteln zur Bekämpfung von Schäd-
25 lingen oder Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Düngemitteln oder mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden.

Die Pflanzenschutz- und Düngemittel können zu den erfindungs-
30 gemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugesetzt werden, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix). Beim Vermischen mit Fungiziden oder Insektiziden erhält man dabei in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

35

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

40 Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Kom-
45 plex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid; Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methyl-

heptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitro-phenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;

- 5 heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-β-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo-β-[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid, N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-
- 15 schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Di-
- 20 hydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dime-
- 25 thyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iodbenzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cy-
- 30 clodedecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-
- 35 ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, α-(2-Chlorphenyl)-α-(4-chlor-
- 40 phenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethyl-amino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyrimidinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- 45 sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-fu-

61

- royl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyace-
tyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-
D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylace-
tyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlor-
5 phenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-[3,5-Dichlor-
phenyl(-5-methyl-5-methoxymethyl)-1,3-oxazolidin-2,4-dion,
3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin,
N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäure-
imid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid,
10 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Di-
fluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol,
N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluor-
methyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsi-
lyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

15

Synthesebeispiele

- Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vor-
schriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangs-
20 verbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die
so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit
physikalischen Daten aufgeführt.

1. N-(2-(N'-(o-Chlorphenyl)-5'-methyl-triazolyl-3'-oxy-
25 methyl)-phenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (Tabelle,
Nr. 11)

- Eine Mischung von 3,3 g (Reinheit ca. 80 %ig, $\hat{=}$ 10 mmol)
N-(2-Brommethylphenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester
30 (WO 93/15046), 2,1 g (10 mmol) N-(o-Chlorphe-
nyl)-3-hydroxy-5-methyltriazol und 2 g (15 mmol) K_2CO_3 in
20 ml DMF wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. An-
schließend verdünnt man die Reaktionsmischung mit Wasser und
extrahiert die wäßrige Phase dreimal mit Methyl-t-butylether.
35 Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser extra-
hiiert, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand
wird säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigsäureethyl-
ester-Gemischen gereinigt. Man erhält 1,1 g (27 %) der Titel-
verbindung als gelbes Öl.

40

1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 7,7 (m, 1H, Phenyl); 7,55 (m, 1H,
Phenyl); 7,4 (m, 6H, Phenyl); 5,35 (s, 2H, OCH_2); 3,72, 3,77
(2s, je 3H, 2 x OCH_3); 2,25, (s, 3H, CH_3)

- 45 2. N-(2-(N'-Phenyl-5'-chlor-triazolyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-N-me-
thoxy-carbaminsäuremethylester (Tabelle, Nr. 15)

62

Eine Mischung von 3,3 g (Reinheit ca. 80%; 10 mmol N-(2-Brommethylphenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (WO 93/15046), 2 g (10 mmol) N-Phenyl-5-chlor-3-hydroxytriazol und 1,8 g (13 mmol) K₂CO₃ in 20 ml DMF wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend verdünnt man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahiert die wäßrige Phase dreimal mit Methyl-t-butylether. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser gewaschen, über MgSO₄ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt. Man erhält 2,7 g (69 %) der Titelverbindung als gelbes Öl.

3. N-(2-N'-Pyridyl-2'-triazoyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (Tabelle, Nr. 40)

Eine Mischung von 2,7 g (Reinheit ca. 80%; 8 mmol N-(2-Brommethylphenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (WO 93/15046), 1,7 g (8 mmol) N-(Pyridyl-2')-3-hydroxytriazol und 1,7 g (12 mmol) K₂CO₃ in 20 ml DMF wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend verdünnt man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahiert die wäßrige Phase dreimal mit Methyl-t-butylether. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser extrahiert, über MgSO₄ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt. Man erhält 1,4 g (49 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper (Fp = 89°C).

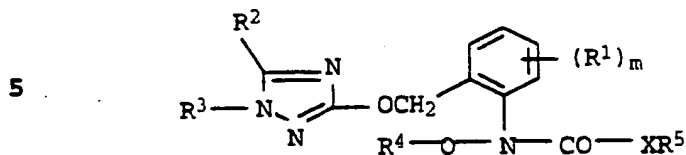
¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 8,9 (s, 1H, Triazolyl); 8,4 (m, 1H, (Het)aryl); 7,8 (m, 3H, (Het)aryl); 7,4 (m, 3H, (Het)aryl); 7,25 (m, 1H, (Het)aryl); 5,45 (s, 2H, OCH₂); 3,8, 4,75 (2s, je 3H, 2 x OCH₃)

35

40

45

Tabelle



10

Nr.	$(R^1)_m$	R^2	R^3	R^4	R^5	X	Fp [°C] oder IR [cm ⁻¹]
1	H	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1539, 1497, 1454, 1440, 1349, 1250, 764
2	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1734, 1542, 1479, 1456, 1441, 1362, 1328, 1247, 759, 746
3	H	H	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	94
4	H	H	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1734, 1541, 1494, 1481, 1456, 1363, 1330, 1251, 1100
5	H	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	94
6	H	H	2-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1736, 1709, 1543, 1492, 1476, 1441, 1362, 1330, 762
7	H	H	3-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1743, 1547, 1454, 1375, 1330, 1309, 1260, 1106, 783, 777
8	H	H	4-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	94
9	H	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1539, 1492, 1456, 1440, 1418, 1349, 1250, 1100
10	H	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	90

45

64

	Nr.	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	Fp [°C] oder IR [cm ⁻¹]
5	11	H	CH ₃	2-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1541, 1488, 1456, 1441, 1348, 1253, 1093, 765
	12	H	CH ₃	3-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1595, 1541, 1483, 1456, 1440, 1349, 759, 747
10	13	H	CH ₃	4-Cl -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1541, 1496, 1456, 1440, 1406, 1349, 1093, 1012
15	14	H	CH ₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1738, 1538, 1495, 1456, 1441, 1349, 1252, 1101, 1023, 766
20	15	H	Cl	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1739, 1542, 1499, 1457, 1440, 1341, 1256, 1009, 763, 694
	16	H	Br	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1538, 1497, 1457, 1441, 1331, 1253, 1104, 1005, 764
25	17	H	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1739, 1536, 1497, 1457, 1440, 1351, 1250, 1101, 990, 765
30	18	H	H	2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1544, 1483, 1457, 1439, 1330, 1250, 1059, 785, 749
	19	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1738, 1544, 1492, 1477, 1457, 1441, 1331, 1254, 1107, 1065
40	20	H	H	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1734, 1569, 1545, 1487, 1457, 1442, 1329, 1253, 1101, 794
45								

65

	Nr.	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	Fp [°C] oder IR [cm ⁻¹]
5	21	H	H	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1736, 1544, 1487, 1457, 1440, 1332, 1248, 1098, 1063, 1037
	22	H	H	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1730, 1583, 1557, 1486, 1455, 1438, 1331, 1259, 1122, 1107
	23	H	H	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1732, 1588, 1558, 1489, 1457, 1437, 1331, 1272, 1254, 1105
10	24	H	CF ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	O	1740, 1540, 1457, 1441, 1348, 1309, 1217, 1194, 1150, 1005
	25	H	H	2-F -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1735, 1546, 1507, 1478, 1457, 1441, 1332, 1240, 1114, 760
	26	H	H	2-Br -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1735, 1543, 1489, 1475, 1456, 1441, 1330, 1250, 1033, 762
15	27	H	H	2-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1735, 1544, 1481, 1457, 1442, 1330, 1317, 1178, 1135, 1116
	28	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	85
	29	H	H	4-Br -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	112
20	30	H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	116
	31	H	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	123
	32	H	H	4-t-Bu -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	108
25	33	H	H	4-F -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	85

66

	Nr.	(R ¹) _m	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	Fp [°C] oder IR [cm ⁻¹]
5	34	H	H	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	118
	35	H	H	2-NO -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	95
	36	H	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	O	1742, 1554, 1516, 1501, 1371, 1331, 1242, 1108, 1090, 851
10	37	3-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	74
15	38	5-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1732, 1545, 1495, 1478, 1442, 1331, 1261, 1108, 1065, 972
	39	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1710, 1541, 1488, 1456, 1440, 1348, 1105, 1088, 1017
20	40	H	H	2-pyridyl	CH ₃	CH ₃	O	89
25	41	H	H	2-pyrazinyl	CH ₃	CH ₃	O	1737, 1547, 1532, 1483, 1447, 1363, 1325, 1259, 1097, 748
	42	H	CH ₃	5-CF ₃ -pyri- dyl-2	CH ₃	CH ₃	O	104
30	43	H	H	5-CF ₃ -pyri- dyl-2	CH ₃	CH ₃	O	80
	44	H	H	Phenyl	H	CH ₃	O	187
35	45	H	H	5-Cl-pyri- diny1-2	CH ₃	CH ₃	O	1707, 1547, 1480, 1471, 1439, 1352; 1330, 986, 956, 769

Beispiele zur Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich
40 durch folgende Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als 20 %-ige Emulsion in einem Gemisch aus
70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6,
Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis
45 ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan®
EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) auf-

67

bereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Wirksamkeit gegen *Puccinia recondita*

5

Blätter von Weizensämlingen (Sorte "Kanzler") wurden mit Sporen des Braunrosts (*Puccinia recondita*) bestäubt. Die so behandelten Pflanzen wurden 24 h bei 20-22°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 90-95% inkubiert und anschließend mit der wässrigen Wirkstoffaufbereitung (63 ppm Wirkstoff) behandelt. Nach weiteren 10 8 Tagen bei 20-22°C und 65-70% relativer Luftfeuchtigkeit wurde das Ausmaß der Pilzentwicklung ermittelt. Die Auswertung erfolgte visuell.

In diesem Test zeigten die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen 15 8, 10, 13, 19, 29, 31, 38 und 41 behandelten Pflanzen einen Befall von 5% und weniger, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Beispiel Nr. 8) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

20

In einem entsprechenden Test zeigten die mit 250 ppm der erfindungsgemäßen Verbindungen 1, 2, 4-10, 12, 13, 15, 17-19, 21, 23-26, 28-31, 33, 37, 38, 42, 43 und 45 behandelten Pflanzen einen Befall von 10% und weniger, während die mit einer aus WO-A 25 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Beispiel Nr. 8) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

Wirksamkeit gegen *Botrytis cinerea*

30

Paprikasämlinge (Sorte: "Neusiedler Ideal Elite") mit 4-5 Blättern wurden mit der Wirkstoffaufbereitung (Aufwandmenge: 500 ppm) tropfnaß gespritzt. Nach dem Abtrocknen wurden die Pflanzen mit einer Konidienaufschwemmung des Pilzes *Botrytis cinerea* be- 35 sprüht und 5 Tage bei 22-24°C bei hoher Luftfeuchtigkeit bewahrt. Die Auswertung erfolgte visuell.

In diesem Test zeigten die mit der erfindungsgemäßen Verbindung Nr. 2 behandelten Pflanzen 5% Befall, während die mit einer aus 40 WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 2, Nr. I/270) behandelten Pflanzen ebenso wie die unbehandelten Pflanzen waren zu 80% befallen waren.

45

Wirksamkeit gegen *Pyricularia oryzae*

Reiskeimlinge (Sorte: "Tai Nong 67") wurden mit der Wirkstoffaufbereitung (Aufwandmenge 250 ppm) tropfnaß gespritzt. Nach 24
5 Stunden wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension des Pilzes *Pyricularia oryzae* besprüht und 6 Tage bei 22-24°C bei einer relativen Luftfeuchtigkeit von 95-99 % bewahrt. Die Beurteilung erfolgte visuell.

10 In diesem Test zeigten die mit der erfindungsgemäßen Verbindung Nr. 2 behandelten Pflanzen 3% Befall, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 2, Nr. I/270) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren; die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

15 In einem entsprechenden Test zeigten die mit 250 ppm der erfindungsgemäßen Verbindungen 2, 6-8, 13, 15, 17-19, 21, 24-38 und 42-45 einen Befall von 5% und weniger während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 2, Nr. I/270)
20 behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren; die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

Wirksamkeit gegen *Fusarium culmorum*

25 Primär-Blätter von Weizensämlingen (Sorte "Kanzler") wurden mit der Wirkstoffaufbereitung (Aufwandmenge 500 ppm) tropfnaß gespritzt. Am folgenden Tag wurden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Fusarium culmorum* infiziert. Die so behandelten Pflanzen wurden 6 Tage bei 22-24°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit
30 von >90% inkubiert. Die Auswertung erfolgte visuell.

In diesem Test zeigten die mit der erfindungsgemäßen Verbindung Nr. 2 behandelten Pflanzen 5% Befall, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 2, Nr. I/270) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren; die unbehandelten Pflanzen
35 waren zu 60% befallen.

Beispiele zur Wirkung gegen tierische Schädlinge

40 Die Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gegen tierische Schädlinge ließ sich durch folgende Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden

- a) als 0,1 %-ige Lösung in Aceton oder
- b) als 10 %-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan® EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole)

10

aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Aceton im Fall von a) bzw. mit Wasser im Fall von b) verdünnt.

Nach Abschluß der Versuche wurde die jeweils niedrigste Konzentration ermittelt, bei der die Verbindungen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollversuchen noch eine 80 - 100 %-ige Hemmung bzw. Mortalität hervorriefen (Wirkschwelle bzw. Minimalkonzentration).

20

25

30

35

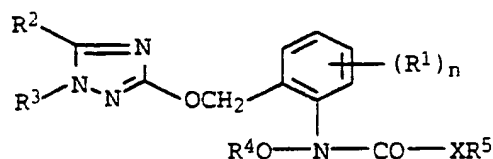
40

45

Patentansprüche

1. 2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-anilide der Formel I

5



10

in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

15 n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

X eine direkte Bindung, O oder NR^a;

20 R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

25 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy oder

30 für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

35

R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

40

R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;

45 ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder

71

ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann;

5

R⁴ Wasserstoff,

10

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;

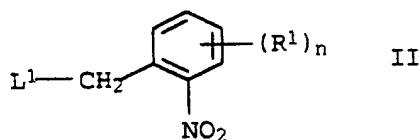
R⁵ Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, oder

15

für den Fall, daß X für NR^a steht, zusätzlich Wasserstoff.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen R⁴ Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylderivat der Formel II,

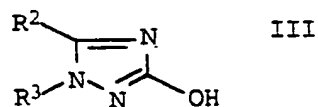
20



25

in der L¹ eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet, in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III

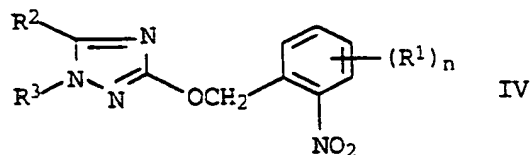
30



35

in das entsprechende 2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-nitrobenzol der Formel IV

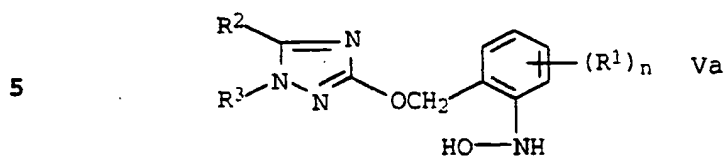
40



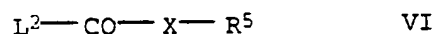
45

72

überführt, IV anschließend zum N-Hydroxyanilin der Formel Va



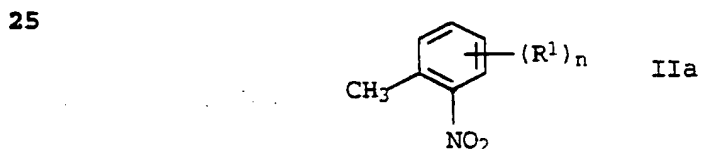
10 reduziert und Va mit einer Carbonylverbindung der Formel VI



15

in der L² eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet, in I umwandelt.

20 3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, in denen R⁴ nicht Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylderivat der Formel IIa

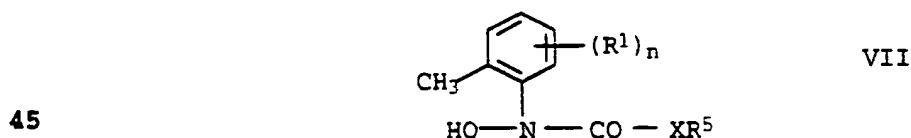


30

zunächst zum entsprechenden Hydroxyanilin der Formel Vb



40 reduziert, Vb mit einer Carbonylverbindung der Formel VI gemäß Anspruch 2 in das entsprechende Anilid der Formel VII



73

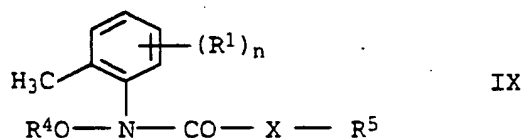
überführt, VII anschließend mit einer Verbindung VIII

 L^3-R^4

VIII

- 5 in der L^3 eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet und R^4 nicht für Wasserstoff steht, in das Amid der Formel IX

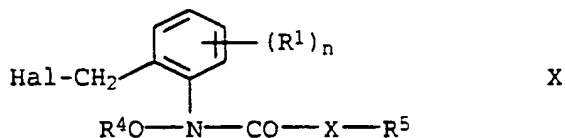
10



15

umwandelt, IX anschließend in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel X

20



25

in der Hal für ein Halogenatom steht, überführt und X in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III gemäß Anspruch 2 zu I umwandelt.

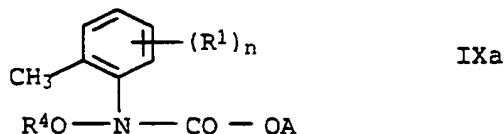
30

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, in denen R^4 nicht Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Verbindung der Formel I, in der R^4 Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der Formel VIII gemäß Anspruch 3 umsetzt.

35

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, in denen X für NR^a steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylanilid der Formel IXa

40

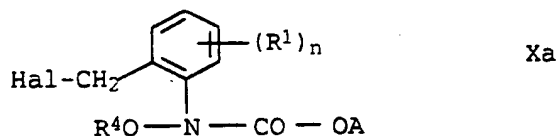


45

74

in der A für Alkyl oder Phenyl steht, in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel Xa

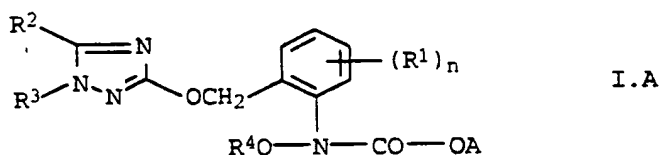
5



10

in der Hal für ein Halogenatom steht, überführt, Xa in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxytriazol der Formel III gemäß Anspruch 2 in eine Verbindung der Formel I.A

15



20

überführt und I.A anschließend mit einem Amin der Formel XI



XIa

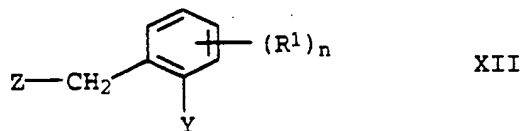
XIb

25

zu I umgesetzt.

6. Zwischenprodukte der Formel XII

30



35

in der die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

40

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy oder

45

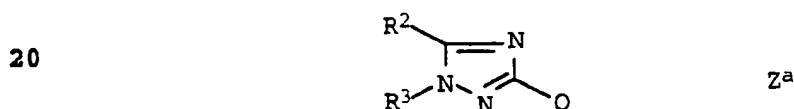
75

5 für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

10 Y NO_2 , NHOH oder NHOR^4 ,

R⁴ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;

15 Z Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Nitro, Halogen,
C₁-C₆-Alkylsulfonyl, ggf. subst. Arylsulfonyl oder eine
Gruppe Z^a



25 R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

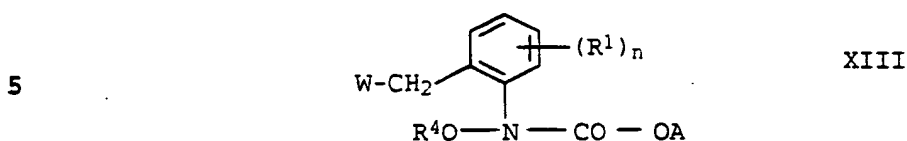
R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl;

ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder

ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann.

76

7. Zwischenprodukte der allgemeinen Formel XIII



10 wobei die Substituenten R¹ und R⁴ sowie der Index n die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben und die Substituenten W und A die folgende Bedeutung haben:

W Wasserstoff oder Halogen, und

15 A Alkyl oder Phenyl.

8. Zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.

20

9. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen geeigneten Mittels.

25

10. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

30

11. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Schädlingen oder die von ihnen zu schützenden Materialien, Pflanzen, Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

35

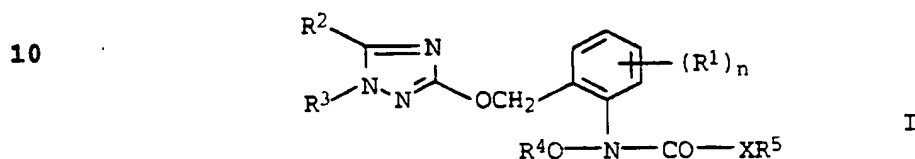
40

45

2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-anilide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung

5 Zusammenfassung

2-[1',2',4'-Triazol-3'-yloxymethylen]-anilide der Formel I



15 in der der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4;

20 X eine direkte Bindung, O oder NR^a;

R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;

25 R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder Alkinyloxy;

30 R² Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkoxy-carbonyl;

R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Hetero-cyclyl, Aryl oder Heteroäryl;

35

R⁴ Wasserstoff,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cyclo-alkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy-carbonyl;

40

R⁵ Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cyclo-alkenyl,

Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Ver-
45 wendung.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP 95/02395

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC C07D249/12 C07D401/04 C07D403/04 A01N43/653 A01N47/08
C07C239/08 C07C271/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D C07C A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,Y	W0-A- 93 15046 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 5 August 1993 cited in the application see the whole document, especially pages 186, 193, 194, 296, 303, 304, 398, 405 and 406	1-5,8-11
X	see especially pages 60	6
X	see especially pages 163, 164, 259, 271, 272, 375, 471 and 472	7
Y	--- EP-A-0525 516 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 3 February 1993 see the whole document, especially p. 27, compound 1a.179 and p. 41, compound 1a.523 --- -/--	1-5, 8-11



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

28 September 1995

Date of mailing of the international search report

-6.10.95

Name and mailing address of the ISA/
European Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US-A-3 547 977 (S.B. RICHTER) 15 December 1970 see example 7	7
P, X	EP-A-0 619 301 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 12 October 1994 see pages 33-35, formula III and example 1-1 until 1-4	6, 7
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=388396 & CHEM. BER., vol. 25, 1892 page 2445	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=390510 & J. MED CHEM., vol. 34, no 9, 1991 pages 2906-2916,	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=1975961 & CHEM. BER., vol. 37, 1904 page 3599	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=2102253 & J. AMER. CHEM. SOC., vol. 80, 1958 page 1168, 1171	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=2764273 & CH, A, 558 783 (LILLY) 1975	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme Frankfurt DE see BRN=3272503 & CHEM. BER., vol. 27, 1984 page 2162	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=5530272 & HELV. CHIM. ACTA, vol. 63, no.8, 1980 pages 2364-2369,</p> <p>---</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=774603, 2081120, 2082093 and 2638401 & JUSTUS LIEBIGS ANN. CHEM., vol. 316, 1901 pages 278, 295, 287, 289</p> <p>---</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=2085686 and 2085706 & BUL. SOC. CHIM. FR., 1966 pages 1848-1858,</p> <p>---</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=2692664 & CHEM. BER., vol. 40, 1907 page 3330</p> <p>---</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE see BRN=3247055 & US, A, 2 334 201 (PARKE, DAVIS & CO.) 1941</p> <p>---</p>	6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP95/02395

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.: 6 (not fully searched)
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

In view of the extremely large number of known compounds that are prejudicial to novelty in claim 6, it is not possible, for reasons of economy (see Guidelines, B-III, 2.1), either to conduct a complete search or to prepare a full report for this claim. The search report in regard to claim 6 was therefore limited to a representative sample of documents.

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/02395

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-9315046	05-08-93	DE-A- 4234012	14-04-94
		DE-A- 4234028	14-04-94
		DE-A- 4234067	14-04-94
		DE-A- 4234081	14-04-94
		AU-B- 3351493	01-09-93
		CA-A- 2127110	05-08-93
		CZ-A- 9401785	15-02-95
		EP-A- 0624155	17-11-94
		FI-A- 943523	27-07-94
		JP-T- 7502747	23-03-95
		NO-A- 942814	28-07-94
EP-A-525516	03-02-93	DE-A- 4124989	04-02-93
		AU-B- 653612	06-10-94
		AU-A- 2059092	28-01-93
		CA-A- 2075354	28-01-93
		JP-A- 5255191	05-10-93
		NZ-A- 243736	25-11-94
US-A-3547977	15-12-70	NONE	
EP-A-619301	12-10-94	AU-B- 661230	13-07-95
		AU-B- 5903494	20-10-94
		CA-A- 2120163	05-10-94
		CN-A- 1094713	09-11-94
		JP-A- 6340607	13-12-94

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 95/02395

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D249/12 C07D401/04 C07D403/04 A01N43/653 A01N47/08
C07C239/08 C07C271/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 6 C07D C07C A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,Y	WO-A-93 15046 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 5 August 1993 cited in the application siehe das ganze Dokument, insbesondere Seiten 186, 193, 194, 296, 303, 304, 398, 405 und 406	1-5,8-11
X	siehe insbesondere Seite 605	6
X	siehe insbesondere Seiten 163, 164, 259, 271, 272, 375, 471 und 472	7
Y	--- EP-A-0 525 516 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 3 February 1993 siehe das ganze Dokument, insbesondere S. 27, Verbindung 1a.179 und S. 41, Verbindung 1a.523 --- -/--	1-5,8-11

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *G* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

28 September 1995

Date of mailing of the international search report

6. 10. 95

Name and mailing address of the ISA
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Allard, M

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern. Aktenzeichen

PCT/EP 95/02395

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US-A-3 547 977 (S.B. RICHTER) 15.Dezember 1970 siehe Beispiel 7 ---	7
P,X	EP-A-0 619 301 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 12.Oktober 1994 siehe Seiten 33-35, Formel III und Beispiele 1-1 bis 1-4 ---	6,7
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=388396 & CHEM. BER., Bd. 25, 1892 Seite 2445 ---	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=390510 & J. MED. CHEM., Bd. 34, Nr. 9, 1991 Seiten 2906-2916, ---	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=1975961 & CHEM. BER., Bd. 37, 1904 Seite 3599 ---	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=2102253 & J. AMER. CHEM. SOC., Bd. 80, 1958 Seite 1168, 1171 ---	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=2764273 & CH,A,558 783 (LILLY) 1975 ---	6
X	DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=3272503 & CHEM. BER., Bd. 27, 1894 Seite 2162 --- -/--	6

1
5

C(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=5530272 & HELV. CHIM. ACTA, Bd. 63, Nr. 8, 1980 Seiten 2364-2369, ----</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=774603, 2081120, 2082093 und 2638401 & JUSTUS LIEBIGS ANN. CHEM., Bd. 316, 1901 Seite 278, 295, 287, 289 ----</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=2085686 und 2085706 & BULL. SOC. CHIM. FR., 1966 Seiten 1848-1858, ----</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=2692664 & CHEM. BER., Bd. 40, 1907 Seite 3330 ----</p>	6
X	<p>DATABASE CROSSFIRE Beilstein Informationssysteme GmbH, Frankfurt DE siehe BRN=3247055 & US,A,2 334 201 (PARKE, DAVIS & CO.) 1941 -----</p>	6

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 1 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr. weil Sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☐ Ansprüche Nr. 6 (unvollständig recherchiert) weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
Im Hinblick auf die extrem grosse Anzahl bekannter Verbindungen, welche dem Anspruch 6 neuheitsschädlich gegenüberstehen, ist, aus wirtschaftlichen Gründen (siehe Richtlinien B-III,2.1), weder eine vollständige Recherche noch ein vollständiger Recherchenbericht für diesen Anspruch möglich. Der Recherchenbericht wurde
3. ☐ darum hinsichtlich Anspruch 6 auf eine repräsentative Auswahl von Dokumenten beschränkt.
Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche der internationalen Anmeldung.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Internationale Recherchenbehörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche der internationalen Anmeldung, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Gebühren erfolgte ohne Widerspruch.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/02395

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-9315046	05-08-93	DE-A- 4234012	14-04-94
		DE-A- 4234028	14-04-94
		DE-A- 4234067	14-04-94
		DE-A- 4234081	14-04-94
		AU-B- 3351493	01-09-93
		CA-A- 2127110	05-08-93
		CZ-A- 9401785	15-02-95
		EP-A- 0624155	17-11-94
		FI-A- 943523	27-07-94
		JP-T- 7502747	23-03-95
		NO-A- 942814	28-07-94
EP-A-525516	03-02-93	DE-A- 4124989	04-02-93
		AU-B- 653612	06-10-94
		AU-A- 2059092	28-01-93
		CA-A- 2075354	28-01-93
		JP-A- 5255191	05-10-93
		NZ-A- 243736	25-11-94
US-A-3547977	15-12-70	KEINE	
EP-A-619301	12-10-94	AU-B- 661230	13-07-95
		AU-B- 5903494	20-10-94
		CA-A- 2120163	05-10-94
		CN-A- 1094713	09-11-94
		JP-A- 6340607	13-12-94